



Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets

Veröffentlichungsnummer:

0 337 263  
A2

(2)

## EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 89105924.8

(51) Int. Cl. 4: C07D 261/18, C07D 275/02,  
A01N 43/80, C07D 413/12,  
C07D 413/04, C07D 417/12

(22) Anmeldetag: 05.04.89

Patentansprüche für folgenden Vertragsstaat: ES.

(30) Priorität: 13.04.88 DE 3812225

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
18.10.89 Patentblatt 89/42

(64) Benannte Vertragsstaaten:  
BE CH DE ES FR GB IT LI NL

(71) Anmelder: BASF Aktiengesellschaft  
Carl-Bosch-Strasse 38  
D-6700 Ludwigshafen(DE)

(72) Erfinder: Freund, Wolfgang, Dr.  
Johann-Gottlieb-Fichte-Strasse 71  
D-6730 Neustadt(DE)  
Erfinder: Kuekenhoehner, Thomas, Dr.

Seidelstrasse 2

D-6710 Frankenthal(DE)

Erfinder: Hamprecht, Gerhard, Dr.

Rote-Turm-Strasse 28

D-6940 Weinheim(DE)

Erfinder: Wuerzer, Bruno, Dr.

Ruedigerstrasse 13

D-6701 Otterstadt(DE)

Erfinder: Westphalen, Karl-Otto, Dr.

Mausbergweg 58

D-6720 Speyer(DE)

Erfinder: Meyer, Norbert

Dossenheimer Weg 22

D-6802 Ladenburg(DE)

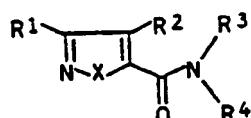
Erfinder: Theobald, Hans, Dr.

Quelchstrasse 6

D-6703 Limburgerhof(DE)

(54) Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäure-amide.

(57) Die Erfindung betrifft Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamide der Formel



EP 0 337 263 A2

in der

X Sauerstoff oder Schwefel,

R<sup>1</sup> Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy,

gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl,

einen 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, der substituiert sein kann,

oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl,

R<sup>2</sup> Formyl, 4,5-Dihydro-oxazol-2-yl oder einen Rest der Formel COYR<sup>5</sup> oder CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>,

wobei

Y für Sauerstoff oder Schwefel,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl,

gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, Halogenalkenyl,



## Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamide

Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte Isoxazol- und Isothiazol-5-carbonsäureamide und ihre Verwendung zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses.

5 Isoxazol- und Isothiazol-carbonsäuren bzw. deren Derivate sind bekannt. Dies sind die 5-Aminocarbonyl-3-methyl-4-isoxazolcarbonsäure, der 5-Aminocarbonyl-3-methyl-4-isoxazolcarbonsäureethylester, das 4,5-Isothiazoldicarboxamid sowie die 5-Carbamoyl-4-isothiazolcarbonsäure (J. Chem. Soc. Perkin Trans. I, 1982, 2391; J. Heterocyclic. Chem. 22, 1561 (1985); J. Chem. Soc. 1959, 3961). Mögliche Verwendungen dieser Substanzen sind nicht beschrieben.

Es wurde gefunden, daß Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamide der Formel Ia

10



15

in der

X Sauerstoff oder Schwefel,

R<sup>1</sup> Wasserstoff,

gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkoxy, Halogen, Cyano oder Phenyl, das durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Cyano oder Nitro substituiert sein kann, substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,

gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, einen 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, der durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Carboxyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl substituiert sein kann,

oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl,

R<sup>2</sup> Formyl, 4,5-Dihydro-oxazol-2-yl oder einen Rest der Formel COYR<sup>5</sup> oder CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>,

wobei

Y für Sauerstoff oder Schwefel,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff,

C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, das durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, Halogen, Cyano, Hydroxy, Trimethylsilyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl, Carboxyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkoxyphosphonyl, Alkaniminoxy, Benzyloxy, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy oder Halogen substituiertes Benzoyl oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, durch Thienyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Phthalimido oder Pyridyl substituiert sein kann,

gegebenenfalls durch Phenyl, das durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro oder Cyano substituiert sein kann, substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl,

C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl,

gegebenenfalls durch Hydroxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl,

C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl,

C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl,

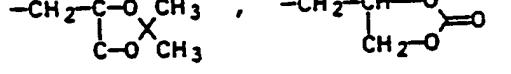
gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl oder Acylamino substituiertes Phenyl,

45 gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl oder Acylamino substituiertes Phenyl,

einen 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff oder einen Benzotriazolrest,

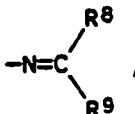
C<sub>6</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkanimino, Phthalimido, Succinimido,

50 für die Reste



-CH<sub>2</sub>-CH(OH)-CH<sub>2</sub>(OH),

für ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali-, Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substituiertes Ammonium oder für den Rest



10 wobei R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> unabhängig voneinander C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Phenyl, Furyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- mit m = 4 bis 7 Kettengliedern bedeuten und R<sup>9</sup> zusätzlich Wasserstoff bedeutet,

15 R<sup>6</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl und

R<sup>7</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl stehen oder wobei R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> eine Methylenkette mit 4 oder 5 Gliedern bilden,

R<sup>3</sup> Wasserstoff,

gegebenenfalls durch Hydroxy, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylamino substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl

20 oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl und

R<sup>4</sup> Wasserstoff, Hydroxyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,

gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylamino, Halogen, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl oder Phenyl, das durch Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio substituiert sein kann, substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl,

25 gegebenenfalls durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl oder

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Alkinyl,

gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl,

30 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylamino, einen gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl oder Halogen substituierten 3- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und gegebenenfalls durch Methyl substituierter Stickstoff, Naphthyl,

oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkanoyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalk-

35 noyl substituiertes Phenyl bedeuten

oder

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> gemeinsam einen Rest der Struktur -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>- Y<sub>p</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten, oder den Rest der Formel

40 -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CO-

bilden,

sowie deren umweltverträgliche Salze, herbizid wirksam sind.

Die Methyl-, Alkoxy-, Alkenyl- und Alkinylreste für R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> können unverzweigt oder verzweigt sein und enthalten vorzugsweise 1 bis 4 C-Atome. Entsprechendes gilt für die Alkylreste, die als Substituenten in den Resten R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> enthalten sein können, sowie für die Alkylgruppen in den Halogenalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkylthio-, Halogenalkylthio-, Dialkylamino-, Alkanoyl-, Halogenalkanoyl- und Alkoxy carbonylresten.

45 Als Halogensubstituenten kommen vorzugsweise Chlor substituenten in Betracht.

Die heterocyclischen Reste für R<sup>1</sup> sind gesättigt oder ungesättigt. In Betracht kommen beispielsweise

50 Tetrahydropyran, Tetrahydrofuryl, Pyrazolyl, Thienyl, Furyl, Pyridyl und Tetrahydrofuryl. Diese Reste können durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-, Carboxyl- oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonylgruppen substituiert sein.

Die heterocyclischen Reste für R<sup>5</sup> können gegebenenfalls gesättigt oder ungesättigt sein. Geeignete Reste sind Thienyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Triazolyl, Imidazolyl, Tetrahydropyran, Pyridyl, Morpholino und Piperidino.

55 Gesättigte oder ungesättigte heterocyclische Reste für R<sup>4</sup> sind beispielsweise Tetrahydropyran, Tetrahydrofuryl, Thiazolyl, Pyridyl, Morpholino, Piperidino, Pyrimidyl.

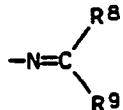
Die erfindungsgemäßen Verbindungen I können beispielsweise mit anorganischen und organischen Säuren oder mit Alkylhalogeniden Additionsalze bilden oder sie können, sofern einer der Substituenten

saure Eigenschaften hat, mit anorganischen und organischen Basen zu Salzen umgesetzt werden. Die entsprechenden Salze gehören ebenfalls zur Erfindung.

Als herbizide Wirkstoffe bevorzugte Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamide sind solche der Formel Ia, in der R<sup>3</sup> Wasserstoff bedeutet.

5 Weiterhin sind Verbindungen der Formel Ia als Wirkstoffe bevorzugt, bei denen X Sauerstoff oder Schwefel, R<sup>1</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, R<sup>2</sup> COYR<sup>5</sup>, R<sup>3</sup> Wasserstoff, R<sup>4</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl bedeuten. Bei diesen Verbindungen bedeutet R<sup>5</sup> vorzugsweise Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder Halogen substituiertes Phenyl oder den Rest

10



15

wobei wiederum R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> vorzugsweise für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl stehen.

Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamide der Formel

20



25

in der X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die für Formel Ia angegebenen Bedeutungen haben, mit der Maßgabe, daß X Schwefel ist, wenn R<sup>1</sup> CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> COOH oder COOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub> und R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeuten, und daß X Sauerstoff ist, wenn R<sup>1</sup> Wasserstoff, R<sup>2</sup> COOH oder CONH<sub>2</sub> und R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeuten, sind neu.

30

Die Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamide der Formel I bzw. Ia können auf folgenden Wegen hergestellt werden:

1. Ein Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel Ib und Ia, in der R<sup>2</sup> COOR<sup>5</sup> und R<sup>5</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl bedeuten (vgl. Schema 1), beruht auf der Umsetzung eines Isoxazol- oder Isothiazol-4,5-dicarbonsäuredialkylesters II (R<sup>8</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl) mit wäßriger Base und anschließende Umsetzung mit Mineralsäure zu einer Carbonsäure III. Als Dicarbonsäureester II kommen insbesondere Niedrigalkylester (R<sup>5</sup> = R<sup>8</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl) in Betracht, wobei Dimethylester und Diethylester besonders bevorzugt sind.

35 Die Reaktion wird so durchgeführt, daß man einen Dicarbonsäuredialkylester II bei Temperaturen zwischen etwa 0 und 80 °C, vorzugsweise zwischen 0 und 50 °C, in einem organischen Lösungsmittel, z.B. Methanol oder Ethanol, mit einer starken Base, z.B. NaOH, KOH oder Ca(OH)<sub>2</sub>, behandelt. Im allgemeinen wird dabei etwa 1 Äquivalent der starken Base in wäßriger Lösung eingesetzt. Nach erfolgter Umsetzung wird abgekühlt und mit einer starken Mineralsäure, z.B. Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert. Die entstehende Carbonsäure III kann auf übliche Art und Weise z.B. durch Absaugen oder durch Extraktion mit einem organischen Lösungsmittel isoliert werden.

40 Zur Überführung der Carbonsäure III in das Carbonsäurehalogenid IV bringt man die Säure III in üblicher Art und Weise mit einem anorganischen Säurehalogenid, wie Thionylchlorid, Phosphortri- oder Phosphorpentahalogeniden, zur Reaktion, wobei die Chloride bevorzugt sind. Dabei wird zweckmäßigerweise das anorganische Säurehalogenid in 1 bis 5 Moläquivalenten, vorzugsweise 1 bis 2 Moläquivalenten, eingesetzt. Man kann ohne Lösungsmittel oder in Gegenwart eines inerten organischen Lösungsmittels wie z.B. Benzol oder Toluol bei Temperaturen zwischen Raumtemperatur und der Siedetemperatur des anorganischen Säurehalogenids bzw. des inerten organischen Lösungsmittels arbeiten. In manchen Fällen kann der Zusatz eines Katalysators, wie Dimethylformamid oder 4-Dimethylaminopyridin, von Vorteil sein. Nach Beendigung der Reaktion kann das Säurehalogenid IV auf übliche Art und Weise isoliert werden, z.B. durch Abdestillation des Überschusses an anorganischem Säurehalogenid und des organischen Lösungsmittels und nachfolgende Destillation des Säurechlorids IV bei Normaldruck oder vermindertem Druck.

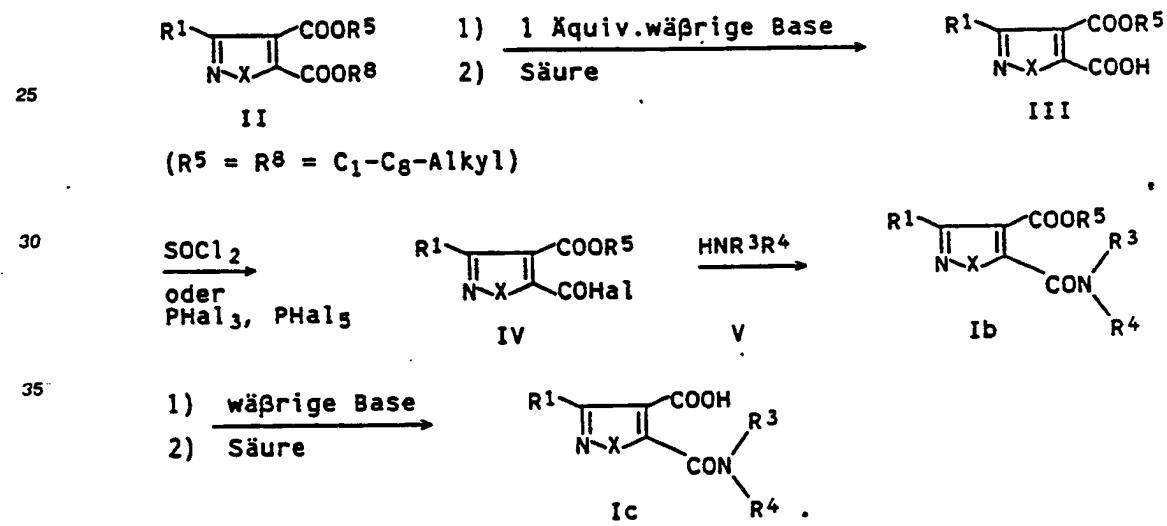
45 50 55 Die Carbonsäureamide Ib erhält man aus den Carbonsäurehalogeniden durch Umsetzung mit einem Amin V. Dabei geht man zweckmäßigerweise so vor, daß man das Carbonsäurehalogenid in einem inerten organischen Lösungsmittel wie Dichlorethan, oder einem Ether wie Diethylether oder Methyl-tert.-butylether mit einem Amin V, ebenfalls gelöst in einem organischen Lösungsmittel, zur Reaktion bringt. Dabei setzt

man das Amin V zweckmäßigerverweise in 2- bis 5-fach molarer Menge, vorzugsweise 2- bis 3-fach molarer Menge ein, um den entstehenden Halogenwasserstoff zu binden. Man kann auch in Gegenwart einer Hilfsbase wie einem tertiären Amin, z.B. Triethylamin, arbeiten. In diesem Fall genügen 1 bis 1,5 Moläquivalente Amin V. Die Reaktionstemperatur kann zwischen 0 und 50 °C, vorzugsweise zwischen 0 und 20 °C betragen. Die Reaktion ist im allgemeinen nach 1 bis 12 Stunden beendet. Das Gemisch kann wie üblich aufgearbeitet werden, beispielsweise durch Hydrolyse mit Wasser und Extraktion des Produktes der Formel Ib mit einem organischen Lösungsmittel und Einengen des organischen Lösungsmittels. Zur Reinigung kann das Produkt der Formel Ib beispielsweise umkristalliert oder chromatographiert werden.

Aus den 4-Alkoxy carbonyl-isoxazol-5-carbonsäureamiden bzw. 4-Alkoxy carbonyl-isothiazol-5-carbonsäureamiden Ib lassen sich die freien Carbonsäuren Ic durch Umsetzung mit wässrigen Basen und anschließender Umsetzung mit Mineralsäuren erhalten. Die Reaktion wird so durchgeführt, daß man den Ester Ib bei Temperaturen zwischen 0 und 80 °C, vorzugsweise zwischen 0 und 50 °C, in einem organischen Lösungsmittel wie z.B. Methanol oder Ethanol mit einer Base wie z.B. NaOH, KOH oder Ca(OH)<sub>2</sub> behandelt. Im allgemeinen werden dabei etwa 1 bis 3 Äquivalente, vorzugsweise 1 bis 1,5 Äquivalente der starken Base in wässriger Lösung eingesetzt. Nach erfolgter Umsetzung wird unter Kühlung mit einer starken Mineralsäure, z.B. Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert. Die entstehenden Carbonsäuren Ic können durch Absaugen oder durch Extraktion mit einem organischen Lösungsmittel und Einengen dieses organischen Lösungsmittels isoliert werden. Zur weiteren Reinigung der Säuren Ic können diese umkristallisiert oder chromatographiert werden.

20

## Schema 1:



40 Die für dieses Verfahren als Ausgangsmaterial benötigten Isoxazol- und Isothiazol-4,5-dicarbonsäure-dialkylester II sind literaturbekannt (J. Org. Chem. 43, 3736 (1978); Chem. Pharm. Bull. 28, 3296 (1980); Tetrahedron 30, 1365 (1974)) oder können nach allgemein literaturbekannten Methoden hergestellt werden.

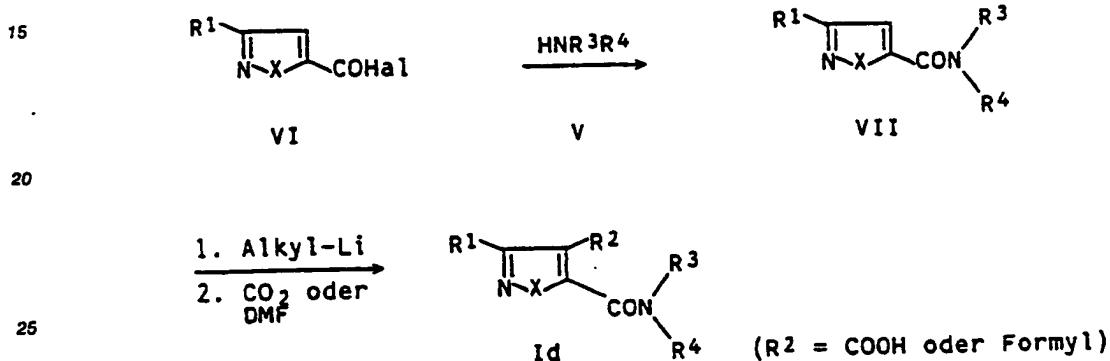
45 2. Ein weiteres Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Id beruht auf der Umsetzung eines Isoxazol- bzw. Isothiazol-5-carbonsäurehalogenids VI mit einem Amin V. Als Carbonsäurehalogenide VI sind die Chloride bevorzugt. Dabei geht man zweckmäßigerverweise so vor, daß man das Carbonsäurehalogenid in einem inerten organischen Lösungsmittel wie Dichlormethan, oder einem Ether wie Diethylether oder Methyl-tert.butylether mit einem Amin V, ebenfalls gelöst in einem organischen Lösungsmittel, zur Reaktion bringt. Dabei setzt man das Amin V zweckmäßigerverweise in 2- bis 5-fach molarer Menge, vorzugsweise 2- bis 3-fach molarer Menge, ein, um den entstehenden Halogenwasserstoff zu binden. Man kann auch in Gegenwart einer Hilfsbase wie z.B. einem tertiären Amin (Triethylamin) arbeiten. In diesem Fall genügen 1 bis 1,5 Moläquivalente Amin V. Die Reaktionstemperatur kann zwischen 0 und 50 °C, vorzugsweise zwischen 0 und 20 °C betragen. Die Reaktion ist im allgemeinen nach 1 bis 12 Stunden beendet. Das Gemisch kann wie üblich aufgearbeitet werden, beispielsweise durch Hydrolyse mit Wasser und Extraktion des Produktes VII mit einem organischen Lösungsmittel und Einengen des organischen Lösungsmittels.

55 Aus den Isoxazol- bzw. Isothiazolamiden VII erhält man die 5-Aminocarbonyl-isoxazol-4-carbonsäuren bzw. 5-Aminocarbonyl-isothiazol-4-carbonsäuren der Formel Id, durch Umsetzung mit Alkyllithium, vorzugs-

weise unter Zugabe eines unter den Reaktionsbedingungen inerten Lösungsmittels, wie Diethylether oder Tetrahydrofuran. In der Regel arbeitet man unter einer Stickstoffatmosphäre bei Temperaturen zwischen -70 und -80 °C. Die Alkylolithiumverbindung wird bei diesem Verfahren im allgemeinen in 2-3-fach molarer Menge bezogen auf eingesetztes Amid der Formel VII verwendet. Nach vollständiger Umsetzung wird das Gemisch mit Kohlendioxid behandelt, vorzugsweise in einem inerten Lösungsmittel wie Diethylether oder z.B. Tetrahydrofuran, wobei man die gewünschten Produkte der Formel Id, in der R<sup>2</sup> Carboxyl bedeutet, erhält.

Nach dem gleichen Verfahren können auch Isoxazol- und Isothiazolamide der Formel Id, bei denen R<sup>2</sup> für Formyl steht, erhalten werden, wenn anstelle des Kohlendioxids Dimethylformamid eingesetzt wird. Man erhält nach üblicher Aufarbeitung substituierte 4-Formyl-isoxazol-5-carbonamide bzw. 4-Formyl-isothiazol-5-carbonamide der Formel Id.

Schema 2:



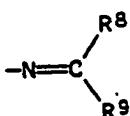
30 Die für dieses Verfahren als Ausgangsmaterial benötigten Isoxazol- und Isothiazol-5-carbonsäurehalogenide VI sind literaturbekannt oder können aus den entsprechenden Carbonsäuren VIII auf übliche Art und Weise, wie bereits oben beschrieben, hergestellt werden.



40 Die hierfür benötigten Carbonsäuren VIII sind ebenfalls literaturbekannt (Chemische Berichte 106, 3345 (1973), J. Chem. Soc. 1959, 3061, J. Chem. Soc. 1963, 2032; Adv. in Heterocyclic Chem. 14, 1 (1972) oder 45 können nach allgemein literaturbekannten Methoden, z.B. aus den entsprechenden Alkoholen oder Aldehyden durch Oxidation oder den entsprechenden Nitrilen durch Hydrolyse hergestellt werden.

45 3. Ein weiteres Verfahren führt zu Verbindungen Ic, in der R<sup>2</sup> COOR<sup>5</sup> und R<sup>5</sup> gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl, Benzyloxy, oder durch Phenyl, das durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl, Benzyloxy, oder durch Phenyl, das durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro oder Cyano substituiert sein kann, substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, nalkyl, Halogen, Nitro oder Cyano substituiert sein kann, substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>6</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkanimino, oder Cyano substituiert sein kann, substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>6</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkanimino, Succinimido oder einen Rest der Formel

50

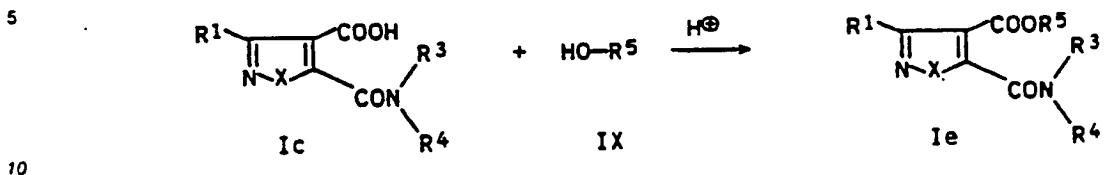


55

bedeuten, durch Umsetzung einer Säure Ic mit einem entsprechenden Alkohol IX in Gegenwart einer starken Mineralsäure wie z.B. Salzsäure oder Schwefelsäure bei einer Temperatur zwischen 0 und 100 °C,

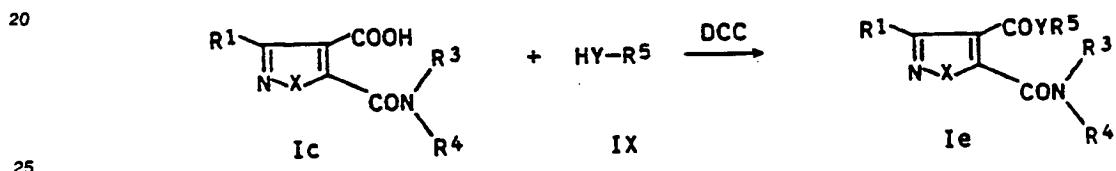
vorzugsweise zwischen 20 und 50 °C. In der Regel wird der Alkohol IX im Überschuß eingesetzt, es kann aber auch ein inertes Lösungsmittel verwendet werden.

### Schema 3:



4. Ein weiteres Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel Ie besteht in der Umsetzung einer Säure Ic mit einem Alkohol oder Thiol IX in Gegenwart eines wasserentziehenden Mittels (z.B. Dicyclohexylcarbodiimid (DCC)) bei einer Temperatur zwischen -20 und 50 °C, vorzugsweise zwischen 0 und 30 °C. In der Regel werden die Ausgangsmaterialien in etwa stöchiometrischer Menge zur Reaktion gebracht. Die Reaktion wird vorzugsweise in Gegenwart eines inerten Lösungsmittels, z.B. Tetrahydrofuran, Dichlormethan oder Toluol, durchgeführt.

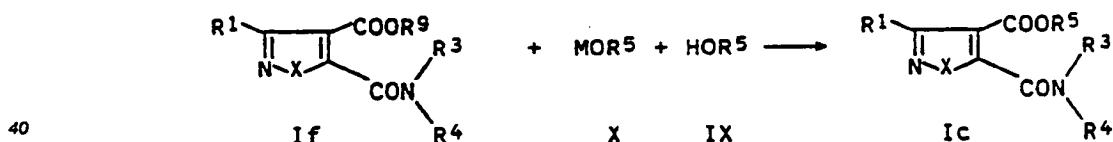
#### Schema 4:



(mit  $\gamma = 0$  oder  $S$ ).

30 5. Ein weiteres Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Ic beruht auf der Umsetzung eines Carbonsäurealkylesters I f mit einem Alkalimetallalkoxid X, wie Natrium- oder Kaliumalkoxid, mit einem entsprechenden Alkohol IX in an sich bekannter Art und Weise bei Temperaturen zwischen 20 °C und der Siedetemperatur des gewählten Alkohols IX.

### 35 Schema 5:



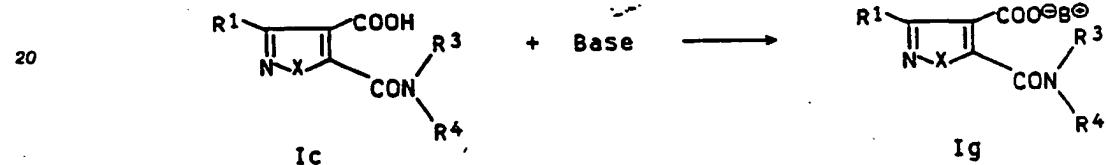
(R<sup>9</sup> = Methyl oder Ethyl)

45 6. Verbindungen der Formel Ig, in der R<sup>2</sup> für C00R<sup>5</sup> steht, wobei R<sup>5</sup> ein salzbildendes Kation wie z.B. Alkalimetall, Erdalkalimetall, Ammonium oder substituiertes Ammonium bedeutet, werden durch Umsetzung einer substituierten Isoxazol- oder Isothiazol-4-carbonsäure Ic mit einem Äquivalent des salzbildenden Kations erhalten. Handelt es sich dabei um ein anorganisches Kation wie z.B. Natrium, Kalium oder Calcium, löst bzw. suspendiert man zweckmäßigerweise die Säure Ic in Wasser oder einem niederen Alkohol oder einer Mischung derselben und gibt ein Äquivalent des salzbildenden Kations zu. Das 50 salzbildende Kation kann z.B. in Form seines Hydroxids, Carbonats oder Bicarbonats, vorzugsweise in Form seines Hydroxids, eingesetzt werden. Die Reaktion ist im allgemeinen nach wenigen Minuten beendet und kann wie üblich z.B. durch Ausfällen und Absaugen oder durch Einengen der Lösung aufgearbeitet werden. Zur Herstellung von Verbindungen Ig, bei denen B<sup>6</sup> für Ammonium oder organisches Ammonium steht, löst 55 bzw. suspendiert man die Säure Ic in einem organischen Lösungsmittel, wie z.B. Diethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan, und behandelt die Mischung mit einem Äquivalent Ammoniak, einem Amin oder einem Tetraalkylammoniumhydroxid.

min, Ethylamin, n-Propylamin, Isopropylamin, n-Butylamin, Isobutylamin, sek.-Butylamin, n-Amylamin, Isoamylamin, Hexylamin, Heptylamin, Octylamin, Nonylamin, Decylamin, Undecylamin, Dodecylamin, Tridecylamin, Tetradecylamin, Pentadecylamin, Hexadecylamin, Heptadecylamin, Octadecylamin, Methylethylamin, Methylisopropylamin, Methylhexylamin, Methylnonylamin, Methylpentadecylamin, Methyloctadecylamin, Ethylbutylamin, Ethylheptylamin, Ethyloctylamin, Hexylheptylamin, Hexyloctylamin, Dimethylamin, Diethylamin, Di-n-propylamin, Diisopropylamin, Di-n-amylamin, Diisoamylamin, Dihexylamin, Diheptylamin, Dioctylamin, Trimethylamin, Triethylamin, Tri-n-propylamin, Triisopropylamin, Tri-n-butylamin, Triisobutylamin, Tri-sek.-butylamin, Tri-n-amylamin, Ethanolamin, n-Propanolamin, Isopropanolamin, Diethanolamin, N,N-Diethylethanol amin, N-Ethylpropanolamin, N-Butylethanolamin, Allylamin, n-Butenyl-2-amin, n-Pentenyl-2-amin, 2,3-Dimethylbutenyl-2-amin, Di-butenyl-2-amin, n-Hexenyl-2-amin, Propylenediamin, Talgamin, Cyclopentylamin, Cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Piperidin, Morpholin und Pyrrolidin.

Bei den Tetraalkylammoniumhydroxiden können z.B. Tetramethyl-, Tetraethyl- oder Trimethylbenzylammoniumhydroxid eingesetzt werden. In der Regel fällt das Ammoniumsalz oder organische Ammoniumsalz aus der Lösung aus und kann nach üblichen Methoden isoliert werden. Alternativ kann das Salz der Formel 1g auch durch Einengen des Lösungsmittels erhalten werden.

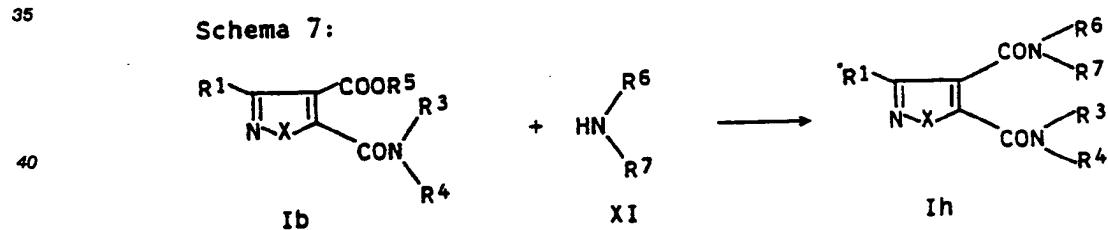
Schema 6:



25

7. Ein anderes Verfahren führt zu Verbindungen 1h, in der  $R^2 CONR^6R^7$  bedeutet. Es besteht in der Umsetzung eines Esters Ib mit einem primären oder sekundären Amin XI. Das Verfahren wird so durchgeführt, daß man einen Ester Ib mit der 1- bis 50-fach molaren Menge Amin XI, gegebenenfalls in einem organischen Lösungsmittel, bei Temperaturen zwischen Raumtemperatur und der Siedetemperatur des Amins oder des organischen Lösungsmittels umsetzt. Als Ester Ib sind Niederalkylester, besonders die Methyl- und Ethylester bevorzugt. Die Reaktionsprodukte 1h können auf übliche Art und Weise, wie z.B. Absaugen oder Einengen der Lösung isoliert werden und gegebenenfalls durch Umkristallisation oder Chromatographie weiter gereinigt werden.

35 Schema 7:

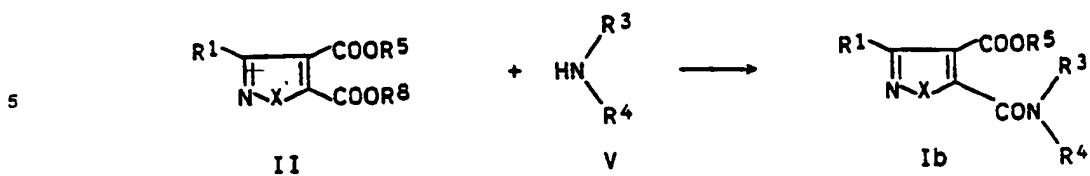


45

8. Ein weiteres Verfahren zur Synthese der Verbindungen Ib besteht in der Umsetzung eines Isoxazol- oder Isothiazol-4,5-dicarbonsäuredialkylesters II mit einem Amin V.

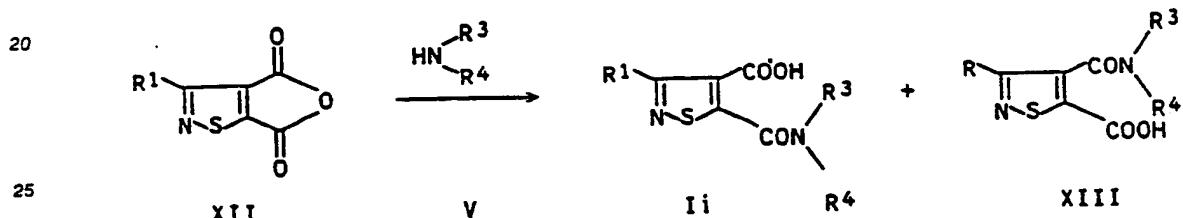
Als Dialkylester II kommen insbesondere Niedrigalkylester, vorzugsweise Dimethylester oder Diethylester, in Betracht. Die Reaktion wird so durchgeführt, daß man einen Dicarbonsäuredialkylester II bei Temperaturen zwischen 0 und 100 °C, vorzugsweise zwischen 50 und 80 °C in einem organischen Lösungsmittel wie z.B. einem Alkohol wie etwa Methanol oder Ethanol mit ungefähr einem Äquivalent eines primären oder sekundären Amins V behandelt. Nach erfolgter Umsetzung wird abgekühlt und abgesaugt oder eingeeengt. Das erhaltene Produkt der Formel Ib kann mit üblichen Standardmethoden, wie Umkristallisation oder Chromatographie, weiter gereinigt werden.

Schema 8:



10 9. Verbindungen der Formel II können durch Umsetzung eines substituierten Isothiazol-4,5-dicarbonsäureanhydriids XII mit einem Amin V erhalten werden. Die Reaktion wird zweckmäßigerweise so durchgeführt, daß man das Anhydrid XII in einem inerten Lösungsmittel, wie einem Ether oder halogenierten Kohlenwasserstoff, vorlegt und etwa molare Mengen eines Amins V, gegebenenfalls ebenfalls gelöst in einem inerten Lösungsmittel, zutropft. Nach beendeter Reaktion wird das Reaktionsprodukt abgesaugt oder durch Einengen des verwendeten Lösungsmittels isoliert. In manchen Fällen können bei diesem Verfahren die 15 isomeren Amide XIII entstehen, wobei im allgemeinen die Amide II die bevorzugten sind.

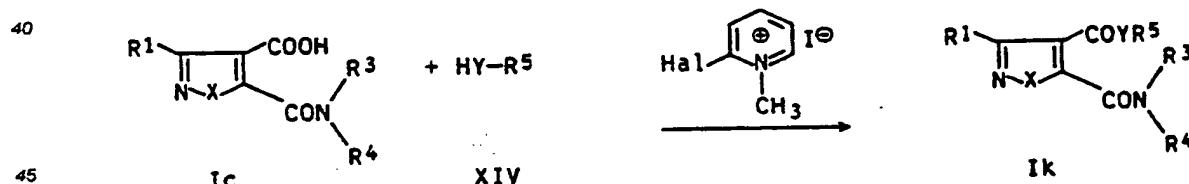
Schema 9:



30 Die für dieses Verfahren als Ausgangsmaterial benötigten Isothiazol-4,5-dicarbonsäureanhydride XII sind literaturbekannt (J. Chem. Soc. 1959, 3061) oder können nach allgemein literaturbekannten Methoden synthetisiert werden.

35 10. Ein weiteres Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel Ic besteht in der Umsetzung einer Säure Ic mit einem Alkohol bzw. Thiol XIV in Anwesenheit von 1-Methyl-2-halogenpyridiniumiodiden bei einer Temperatur zwischen 20 und 80 °C, vorzugsweise zwischen 30 und 40 °C. Die Reaktion wird im Gegenwart eines inerten Lösungsmittels, z.B. Dichlormethan oder Toluol, durchgeführt. Das Verfahren ist im Prinzip literaturbekannt (Chem. Lett., 1045 (1975); ibid., 13 (1976); ibid., 49/1976).

Schema 10:

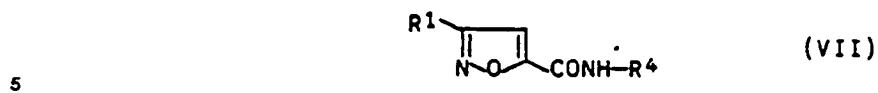


50 Die folgenden Beispiele erläutern die Herstellung der Vorprodukte für die Synthese der Verbindungen I bzw. Ia:

## Beispiel a

55 Zu 10,0 g 3-Ethyl-isoxazol-5-carbonsäurechlorid in 150 ml Dichlormethan werden unter Eiskühlung 11,7 g Anilin zugetropft. Man röhrt über Nacht bei Raumtemperatur nach, versetzt mit Wasser und konz. Salzsäure und trennt die organische Phase ab. Nach Waschen der organischen Phase mit Natriumbicarbonatlösung und Einengen erhält man 11,8 g 3-Ethyl-isoxazol-5-carbonsäureanilid als farblose Kristalle vom Fp. 122-124 °C.

Auf analoge Weise können beispielsweise die Isoxazol-5-carbonsäureamide VII synthetisiert werden:

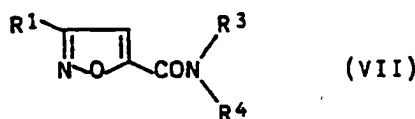


	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	Fp [°C]
10	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	103-106
	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	
	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	
15	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
	CH <sub>3</sub>	H	167-171
	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	92- 93
	CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	55- 60
20	CH <sub>3</sub>	1-Ethylcyclohexyl	ö1
	CH <sub>3</sub>	4-Methyl-tetrahydro- pyran-4-yl	63- 65
25	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	145-147
	CH <sub>3</sub>	4-C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	216-219
30	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	146-148
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	85- 87
35	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	67- 70
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	170-173
40	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	121-122
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	
45	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	69- 73
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	69- 72
50	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	79- 80
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	122-125
55	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	67- 68
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	sec.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	133-135
60	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	85- 86
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	116-118
65	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	118-120
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	33- 34
70	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	65- 66
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	42
75	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	34- 36
80	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	ö1
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	ö1
85	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	88- 90
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	152-154

	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	Fp [°C]
5	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	1-Methyl-cyclohexyl	
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	1-Ethylcyclohexyl	50- 51
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-Methyl-tetrahydro- pyran-4-yl	94- 96
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-Ethyl-tetrahydro- pyran-4-yl	50- 51
10	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -cycloC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	83
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	65- 66
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	99-106
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C≡CH	85- 86
15	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	79- 81
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	87- 89
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	106-108
20	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	176-178
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	74- 78
	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	120-122
	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	129-133
25	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	121-122
	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	158-161
	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	104-108
	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	139-140
30	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	121-122
	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	144-146
	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	
	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	180-181
35	Tetrahydropyran-3-yl	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	102-104
	Tetrahydropyran-3-yl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	110-114
	Tetrahydropyran-3-yl	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	108-110
	Tetrahydropyran-3-yl	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	
40	Tetrahydropyran-3-yl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	149-151
	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	
45	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	
	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	
	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	166-171
	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	128-132
50	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	229-232
	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	163-165
	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	114-117
55	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	106-107
	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	180-186

	R1	R4	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H.NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	119-121
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Tetrahydrofur-3-yl	75- 78
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Thiazol-2-yl	165-168
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	5-Methyl-thiazol-2-yl	149-153
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	5-Ethyl-thiazol-2-yl	157-163
10	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	5-n-Propyl-thiazol-2-yl	140-145
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CN	88- 92
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> CN	95- 97
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	33- 35
15	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Pyrid-2-yl	104-106
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Pyrid-3-yl	150-152
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Pyrid-4-yl	185-187
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Pyrimid-2-yl	94- 99
20	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	108-110
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	104-106
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	85- 86
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	118-119
25	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	136-137
	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	150-152
	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	107-111
	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	138-142
30	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	99-101
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	131-133
	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	111-113
	CH <sub>3</sub>	Morpholino	190-192
35	CH <sub>3</sub>	Piperidino	158-161
	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	146-148
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Piperidino	133-135
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Morpholino	178-179
40	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	97- 99
	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	128-130
	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	85- 88
	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	109-112
45	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	97- 99
	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	137-140
	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	74- 76
	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	97-100
50	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	82- 86
	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	60-64
	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	118-120
	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	114-115
55	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	88- 89

	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H.NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5			
	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	108-109
	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	146-148
	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	62- 66
10	CH <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	50- 55
	CH <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	55- 60
	2-Methoxyphenyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	119-120
	2-Methoxyphenyl	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	160-163
15	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	77- 80
	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	102-105
	CH <sub>3</sub> O-CH(CH <sub>3</sub> )-	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	76- 79
	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	148-149
20	2,6-Difluorphenyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	118-122
	2,6-Difluorphenyl	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	128-132
	CH <sub>3</sub>	cyclo-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	114-115
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	cyclo-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	84- 85
25	CH <sub>3</sub> O	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	65- 68



	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Fp [°C]
35	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	61

40

**Beispiel b**

45 Zu 18,9 g Kaliumhydroxid in 100 ml Wasser werden bei Raumtemperatur 65 g 3-Methyl-isoxazol-4,5-dicarbonsäurediethylester gelöst in 100 ml Ethanol zugetropft. Nach 16 Stunden wird auf 300 ml Wasser gegossen, mit Ether extrahiert und die wäßrige Phase mit konz. Salzsäure eingesäuert. Man extrahiert mit Dichlormethan und erhält nach dem Einengen 3-Methyl-4-ethoxycarbonyl-isoxazol-5-carbonsäure als farblose Kristalle vom Fp. 54-58 °C.

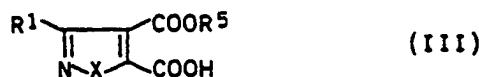
50

**Beispiel c**

55 Zu 85,5 g 3-Ethyl-isothiazol-4,5-dicarbonsäuredimethylester in 300 ml Methanol wird unter Eiskühlung eine Lösung aus 14,9 g NaOH in 120 ml Wasser und 150 ml Methanol zugetropft. Nach 2 Stunden wird eingeeengt, zum Rückstand 1,5 l Wasser zugegeben, nachgerührt und mit Ether extrahiert. Die wäßrige Phase säuert man mit konz. Salzsäure an und schüttelt mit Dichlormethan aus. Einengen der organischen Phasen liefert 76,4 g 3-Ethyl-4-methoxycarbonyl-isothiazol-5-carbonsäure vom Fp. 43-45 °C.

Analog Beispielen b und c können beispielsweise die Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäuren III synthetisiert werden:

5



10

	R <sup>1</sup>	R <sup>5</sup>	X	Fp [°C]
15	H	CH <sub>3</sub>	O	
	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	
20	H	CH <sub>3</sub>	S	
	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
25	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	
	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	75- 81
30	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	O	
35	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
40	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	O	
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	
45	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	S	
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
50	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	O	
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	
55	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	S	ö1
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
60	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	O	
	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	
65	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	S	
	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
70	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	O	
	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	
75	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	S	
	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	

45

50

55

	R <sub>1</sub>	R <sub>5</sub>	X	Fp [°C]
5	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	O	
	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	
	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	S	
	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	O	
	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	
10	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	S	
	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
	Tetrahydropyran-3-yl	CH <sub>3</sub>	O	
	Tetrahydropyran-3-yl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	
15	Tetrahydropyran-3-yl	CH <sub>3</sub>	S	
	Tetrahydropyran-3-yl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
	Tetrahydropyran-3-yl	CH <sub>3</sub>	O	
	Tetrahydropyran-3-yl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
20	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	O	
	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	
	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	S	
	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	
	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	O	139-141
	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	

30 Herstellungsbeispiele für Verbindungen I bzw. Ia

Beispiel 1

35 Zu 10 g 3-Methyl-isoxazol-4,5-dicarbonsäurediethylester gelöst in 100 ml Methanol werden 2,9 g Isopropylamin zugetropft und anschließend zum Rückfluß erhitzt. Nach 7 Stunden wird eingeeengt und das verbleibende Öl an Kieselgel chromatographiert (Toluol : Aceton = 9 : 1). Man erhält 5-isoverbleibende Propylaminocarbonyl-3-methyl-4-isoxazol-carbonsäuremethylester als farblose Kristalle vom Fp. 64-66 °C (Verbindung Nr. 1005)

Beispiel 2

45 2,6 g Ester aus Beispiel 1 und 0,8 g Kaliumhydroxid werden in 20 ml Wasser und 20 ml Ethanol 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird mit Wasser verdünnt, mit konz. Salzsäure angesäuert und mit Dichlormethan ausgeschüttelt. Nach dem Einengen erhält man 1,8 g 5-isopropylaminocarbonyl-3-methyl-4-isoxazolcarbonsäure, farblose Kristalle vom Fp. 86-92 °C (Verbindung Nr. 1004)

50

Beispiel 3

55 Zu 9,0 g Anilid aus Beispiel a, gelöst in 200 ml absolutem Tetrahydrofuran, werden bei -70 °C 70 ml n-Butyllithium (1,6 molar in n-Hexan) zugetropft. Man führt eine halbe Stunde nach und gießt das Reaktionsgemisch auf 500 g festes Kohlendioxid. Nach Stehen über Nacht wird eingeeengt und der Rückstand zwischen H<sub>2</sub>O, Natronlauge und Essigsäureethylester verteilt. Durch Einengen der Essigsäureethylesterphase lassen sich 2,0 g Ausgangsmaterial zurückgewinnen. Durch Ansäuern der wäßrigen Phase mit konz.

Salzsäure und Absaugen erhält man 8,30 g 5-Anilinocarbonyl-3-ethyl-4-isoxazolcarbonsäure, farblose Kristalle vom Fp. 150-152 °C (Verbindung Nr. 1015)

5 Beispiel 4

5,0 g 5-tert.-Butylaminocarbonyl-3-methyl-4-isoxazolcarbonsäure werden in 200 ml Methanol gelöst und 5 ml konz. H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> zugegeben. Nach 2 Tagen wird eingeengt, der Rückstand zwischen Essigsäureethylester und Wasser verteilt und die organische Phase eingeengt. Man erhält 4,0 g 5-tert.-Butylaminocarbonyl-3-methyl-4-isoxazolcarbonsäuremethylester als farbloses Öl (Verbindung Nr. 1007).  
10 H-NMR (CDCl<sub>3</sub>): δ = 1,48 (s;9H), 2,50(s;3H), 3,99(s;1H), 9,42 (bs;1H,NH).

Beispiel 5

15

a) 3-Ethyl-4-methoxycarbonyl-isothiazol-5-carbonsäurechlorid

73 g Carbonsäure aus Beispiel c und 80 g Thionylchlorid werden in 200 ml Toluol in Gegenwart von 20 etwas Dimethylformamid bis zur Beendigung der Gasentwicklung zum Rückfluß erhitzt. Das nach dem Einengen in quantitativer Ausbeute verbleibende rohe Carbonsäurechlorid wird direkt weiter umgesetzt.

b) 5-iso-Propylaminocarbonyl-3-ethyl-isothiazol-4-carbonsäuremethylester

25

Zu 16,5 g rohem Säurechlorid aus a) in 200 ml Dichlormethan werden unter Eiskühlung 8,4 g iso-Propylamin langsam zugetropft. Man röhrt über Nacht nach, hydrolysiert mit 150 ml Wasser und trennt die organische Phase ab. Nach Waschen der organischen Phase mit Bicarbonatlösung, verdünnter Salzsäure und Wasser wird eingeengt. Man erhält 16,2 g 5-iso-Propylaminocarbonyl-3-ethyl-isothiazol-4-carbonsäuremethylester vom Fp. 55-56 °C (Verbindung Nr. 3007).

Beispiel 6

35 Zu 11 g Ester aus Beispiel 5 in 50 ml Ethanol werden 2,8 g KOH in 30 ml Wasser zugegeben und über Nacht bei Raumtemperatur nachgerührt. Man verdünnt mit 150 ml Wasser, extrahiert mit Ether und säuert die wäßrige Phase mit konz. Salzsäure an. Ausschütteln mit Dichlormethan und Einenigen liefert 10 g 5-iso-Propylaminocarbonyl-3-ethyl-isothiazol-4-carbonsäure vom Fp. 138-140 °C (Verbindung Nr. 3006).

40

Beispiel 7

45 4,0 g 5-tert.-Butylaminocarbonyl-3-methyl-4-isoxazolcarbonsäuremethylester und 50 ml konz. Ammoniak extrahiert und eingeengt. Man erhält 5-tert.-Butylaminocarbonyl-3-methyl-4-isoxazol-carbonamid als farblose Kristalle vom Fp. 155-158 °C (Verbindung Nr. 1).

Beispiel 8

50

Zu 8 g 3-Methyl-isoxazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml Tetrahydrofuran werden bei -78 °C 56 ml Butyllithium (1,6 molar in n-Hexan) zugetropft. Man röhrt 1 Stunde nach und tropft dann langsam 22 ml Dimethylformamid zu. Man lässt über Nacht auf Raumtemperatur kommen, hydrolysiert mit Wasser, neutralisiert mit konzentrierter Salzsäure und extrahiert mit Ether. Das nach dem Einengen verbleibende Öl wird an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigester chromatographiert. Man erhält als erste Fraktion 4-Formyl-3-methylisoxazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid, hellgelbe Kristalle vom Fp. 36-38 °C (Verbindung Nr. 2).

## Beispiel 9

## a) 3-Methyl-4-ethoxycarbonyl-isoxazol-5-carbonsäurechlorid

5 13,3 g Carbonsäure aus Beispiel b und 20 ml Thionylchlorid werden in Gegenwart von etwas Dimethylformamid bis zur Beendigung der Gasentwicklung zum Rückfluß erhitzt. Das nach dem Einengen in quantitativer Ausbeute verbleibende rohe Carbonsäurechlorid wird direkt weiter umgesetzt.

10 b) Zu 5 g rohem Säurechlorid aus a) in 100 g Dichlormethan werden unter Eiskühlung 3,4 g Diethylamin langsam zugetropft. Man röhrt über Nacht nach, hydrolysiert mit Wasser und trennt die organische Phase ab. Nach Waschen der organischen Phase mit Bicarbonat wird eingeengt. Man erhält 5,0 g 5-Diethylaminocarbonyl-3-methyl-isoxazol-4-carbonsäureethylester als braunes Öl (Verbindung Nr. 3).  
H-NMR (CDCl<sub>3</sub>): δ = 1.15(t;3H), 1.27 und 1.31(2t;6H), 2.50(s;3H), 3.17(q;2H), 3.58(q;2H), 4.28(q;2H).

15

## Beispiel 10

20 5,0 g Ester aus Beispiel 9 und 1,4 g Kaliumhydroxid werden in 10 ml Wasser und 20 ml Ethanol bei Raumtemperatur gerührt. Nach beendeter Reaktion verdünnt man mit Wasser und extrahiert mit Dichlormethan. Anschließend wird die wäßrige Phase mit Salzsäure angesäuert, mit Dichlormethan extrahiert und eingeengt. Man erhält 3,0 g 5-Diethylaminocarbonyl-3-methyl-isoxazol-4-carbonsäure als helles Öl (Verbindung Nr. 4).  
H-NMR (CDCl<sub>3</sub>): δ = 1.28 und 1.32(2t;6H), 2.60(s;3H), 3.59 und 3.62(2q;4H), 10.50(bs;1H,COOH).

25

## Beispiel 11

30 Zu einer gerührten Suspension von 4,1 g 1-Methyl-2-chlor-pyridiniumiodid in 40 ml Dichlormethan tropft man bei Raumtemperatur ein Gemisch aus 1,2 g 2-Methyl-propan-2-thiol, 3,0 g 5-tert.-Butylaminocarbonyl-3-methyl-isoxazol-4-carbonsäure und 5,9 g Tri-n-butylamin in 20 ml Dichlormethan. Man erhitzt 3 h unter Rückfluß, zieht das Solvents im Vakuum ab und reinigt das Rohprodukt durch Säulenchromatographie an Kieselgel. Man erhält 2,1 g 5-tert.-Butylaminocarbonyl-3-methyl-isoxazol-4-carbonsäure-tert.-butylthioester als gelbes Öl (Verbindung Nr. 2003).

35 Analog den Beispielen 1 bis 10 können beispielsweise die in den folgenden Tabellen 1 bis 3 angeführten Verbindungen hergestellt werden.

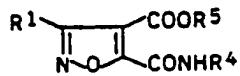
40

45

50

55

Tabelle 1

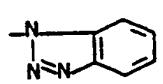
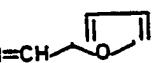


5	Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>4</sup>	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
10	1001	H	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
	1002	H	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	ö1 1.55(s;9H), 7.50 (bs; 1H, NH), 8.78(s;1H)
15	1003	CH <sub>3</sub>	H	H	266-268
	1004	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	86- 92
	1005	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	64- 66
	1006	CH <sub>3</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	92- 94
	1007	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
20	1008	CH <sub>3</sub>	H	1-Ethylcyclohexyl	119-121
	1009	CH <sub>3</sub>	H	4-Methyltetrahydro- pyran-4-yl	80- 87
25	1010	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	204-210
	1011	CH <sub>3</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	233-237
	1012	CH <sub>3</sub>	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	188-191
	1013	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	63- 66
	1014	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	53- 58
30	1015	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	150-152
	1016	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	193-196
	1017	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	160-162
	1018	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	
	1019	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	CH <sub>3</sub>	147-148
35	1020	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	100-101
	1021	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	85- 86
	1022	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	98- 99
	1023	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	96- 97
40	1024	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	112-114
	1025	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	sec-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	ö1 1.00(t;3H), 1.32(d;3H), 1.37(d;6H), 1.64(quint; 2H), 3.78(sept; 1H), 4.15 (m;1H), 7.00 (bs;1H,NH)
45					
50					

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>4</sup>	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5	1026	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> 94- 98
	1027	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> 44- 46
	1028	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> 52- 53
	1029	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> 89-91
	1030	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> ö1 1.35(d;3H), 1.56(s;6H), 2.18(s;3H), 2.99(s;2H), 3.77(sept;1H), 7.30(bs;1H, NH)
10	1031	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>
	1032	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub> 116-118
	1033	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> 69- 71
	1034	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
	1035	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> 74- 76
	1036	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> 112-114
	1037	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	1-Ethylcyclohexyl 89- 90
	1038	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	4-Methyltetrahydro- pyran-4-yl 129-130
25	1039	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	1-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -cycloC <sub>6</sub> H <sub>11</sub> 144-146
	1040	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> 92- 94
	1041	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> ö1;1.35(d;6H), 1.62(s;6H), 3.78(sept;1H), 5.20(d;1H), 5.25(d;1H), 6.10(dd;1H), 7.10(bs;1H, NH)
	1042	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ö1 1.30(d;6H), 3.74(sept;1H), 4.70(d;2H), 7.35(bs;5H), 7.85(bt;1H, NH)
30	1043	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> 76
	1044	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> 138-140
	1045	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> 170-173
	1046	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> 127
	1047	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> 84- 85
	1048	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> 129-133
	1049	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	
55				

	Nr.	R1	R5	R4	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5	1050	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	132-137
	1051	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	188-191
	1052	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	160-162
10	1053	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	116-118
	1054	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	158-159
	1055	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	142-143
	1056	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	
15	1057	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	198-199
	1058	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	165-168
	1059	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	165-168
	1060	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	220
20	1061	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	1062	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	209-211
	1063	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Succinimido	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	108-109
	1064	CH <sub>3</sub>	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C≡CH	80- 87
25	1065	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C≡CH	82- 86
	1066	CH <sub>3</sub>	Na <sup>⊕</sup>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	220
	1067	CH <sub>3</sub>	K <sup>⊕</sup>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	288
	1068	CH <sub>3</sub>	H <sub>3</sub> N <sup>⊕</sup> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	184-187
	1069	CH <sub>3</sub>	H <sub>3</sub> N <sup>⊕</sup> -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	124-126
30	1070	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Na <sup>⊕</sup>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	150
	1071	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	K <sup>⊕</sup>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	220
	1072	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H <sub>3</sub> N <sup>⊕</sup> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	170-172
	1073	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H <sub>3</sub> N <sup>⊕</sup> -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	105-108
35	1074	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Succinimido	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	163-165
	1075	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	68- 70
	1076	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> C≡CH	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	δ1 1.35(t;3H), 1.48(s;9H), 2.63(t;1H), 2.96; 4.98 (d;2H), 8.95(bs; 1H, NH)
40					
45	1077	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	74- 76
	1078	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	78- 80
	1079	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	87- 88
50	1080	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	162-163
	1081	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Succinimido	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	126-127
	1082	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Succinimido	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	172-174
	1083	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Succinimido	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	176-177
55	1084	Tetrahydro- pyran-3-yl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	157-160

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>4</sup>	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5	1085	Tetrahydro- pyran-3-yl	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> 91- 95
	1086	Tetrahydro- pyran-3-yl	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> 158-160
10	1087	Tetrahydro- pyran-3-yl	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> 152-157
	1088	CH <sub>3</sub>	Pyrid-3-yl- methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
15	1089	CH <sub>3</sub>	Thien-2-yl- methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1090	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
20	1091	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> I <sup>+</sup> <sup>⊖</sup>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1092	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1093	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
25	1094	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(C <sub>1</sub> )=CH <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1095	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -C≡C-CH <sub>2</sub> OH	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1096	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH-O <sub>X</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -O CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
30	1097	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH-OH CH <sub>2</sub> -OH	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1098	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH-O <sub>X</sub> CH <sub>2</sub> -O	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
35	1099	CH <sub>3</sub>	Phenethyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1100	CH <sub>3</sub>	-CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )COOCH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
40	1101	CH <sub>3</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1102	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1103	CH <sub>3</sub>	Tetrahydro- pyran-2-yl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
45	1104	CH <sub>3</sub>	Tetrahydro- fur-2-yl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1105	CH <sub>3</sub>	(4-Brom-benzoyl)- methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
50	1106	CH <sub>3</sub>	(4-Methoxybenzoyl) methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1107	CH <sub>3</sub>	-CH(COOCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>

Nr.	R1	R5	R4	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5	1108	CH <sub>3</sub>	Phthalimidomethyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1109	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1110	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1111	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -PO(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
10	1112	CH <sub>3</sub>	Fur-2-yl-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1113	CH <sub>3</sub>	Tetrahydrofur-2-yl-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1114	CH <sub>3</sub>	Pyrid-2-ylmethyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
15	1115	CH <sub>3</sub>	Pyrid-4-ylmethyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1116	CH <sub>3</sub>	Piperidino	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1117	CH <sub>3</sub>	Phthalimido	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
20	1118	CH <sub>3</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1119	CH <sub>3</sub>	-N=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
25	1120	CH <sub>3</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1121	CH <sub>3</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> )CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1122	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CON(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
30	1123	CH <sub>3</sub>	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1124	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1125	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1126	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Tetrahydro-pyran-2-yl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
35	1127	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Tetrahydro-fur-2-yl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1128	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-Brom-benzoyl)-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
40	1129	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(4-Methoxybenzoyl)-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1130	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH(COOCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>

45

50

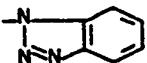
55

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>4</sup>	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5	1131	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Phthalimidomethyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1132	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1133	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1134	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -PO(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
10	1135	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Fur-2-ylmethyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1136	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Tetrahydrofur-2-yl-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1137	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Pyrid-2-yl-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
15	1138	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Pyrid-4-yl-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1139	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Pyrid-3-yl-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1140	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Thien-2-yl-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1141	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
20	1142	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> <sup>+</sup> I <sup>-</sup>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1143	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1144	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
25	1145	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> C(Cl)=CH <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1146	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -C≡C-CH <sub>2</sub> OH	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1147	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
30	1148	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH(OH) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1149	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
35	1150	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Phenethyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1151	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )COOCH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
40	1152	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Piperidino	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1153	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Phthalimido	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>

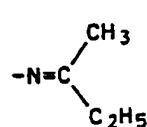
45

50

55

Nr.	R1	R3	R4	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]	
5					
1154	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
1155	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-N=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
10					
1156	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-N=CH- 	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
1157	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> )CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
15	1158	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> -CON(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1159	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
1160	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
1161	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
20	1162	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Tetrahydro-	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
		pyran-2-yl			
1163	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Tetrahydro-	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
		fur-2-yl			
25	1164	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (4-Brom-benzoyl)-	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
		methyl			
1165	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (4-Methoxybenzoyl)-	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>			
		methyl			
30	1166	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH(COOCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
35	1167	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Phthalimidomethyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	64- 69	
1168	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>			
1169	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>			
1170	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> -PO(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>			
35	1171	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Fur-2-ylmethyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
1172	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Tetrahydrofuran-2-	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>			
		yl-methyl			
40	1173	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Pyrid-2-yl-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Öl; 1.30 (s;6H), 1.44 (s;9H), 3.40 (sept;1H), 5.52 (s;2H), 7.20-8,64 (m;4H), 8.60 (bs;1H,NH)	
45					
1174	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Pyrid-4-yl-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>			
1175	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Pyrid-3-yl-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>			
50	1176	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Thien-2-yl-methyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
1177	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>			
55	1178	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> N <sup>+</sup> (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> I <sup>-</sup>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
1179	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>			
65	1352	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		

	Nr.	R1	R5	R4	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5	1353	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> C(C <sub>1</sub> )=CH <sub>2</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
	1354	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> C≡C-CH <sub>2</sub> OH		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
10	1355	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	X	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
	1356	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(OH) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -OH	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
15	1357	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
	1180	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Phenethyl		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
20	1181	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )COOCH <sub>3</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
	1182	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Piperidino		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
	1183	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Phthalimido		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
25	1184	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
	1185	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -N=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
30	1186	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -N=CH-		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
	1187	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH(CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> )(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
	1188	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> -CON(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	91- 93
35	1189	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
	1190	CH <sub>3</sub> -N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	108-109
	1191	CH <sub>3</sub> Cyclohexanimino		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	91- 92
	1192	CH <sub>3</sub> -N=C(cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	50- 52
40	1193	CH <sub>3</sub> H		-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	225-227
	1194	CH <sub>3</sub> H		Piperidino	162-164
	1195	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -C≡CH		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	90- 95
	1197	CH <sub>3</sub> 2-NO <sub>2</sub> -4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	δ1;1.44(s;9H), 2.59(s;3H), 7.24 und 8.30 (m;3H), 8.16 (bs;1H, NH)
45					

Nr.	R1	R5	R4	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
1198	CH <sub>3</sub>	3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	156-159
5 1199	-CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	192-197
1200	CH <sub>3</sub>	H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	145-148
1201	CH <sub>3</sub>	H	cyclo-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	141-142
1202	CH <sub>3</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	135-137
10 1203	CH <sub>3</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	91- 93
1204	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	151-154
1205	CH <sub>3</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	77- 79
1207	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	88- 89
15 1208	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Succinimido	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	132-136
1209	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	132-134
1210	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	82- 83
1211	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	66- 68
20 1212	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Succinimido	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	126-129
1213	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Succinimido	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	104-106
1214	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	ö1 0.70(m;2H), 0.90(m;2H), 1.00(t;3H), 1.78(m;2H), 2.16 und 2.19
25				(2s;6H), 2.92 (t;2H), 3.00 (m;1H), 9.24 (bs;1H, NH)
30				104-106
1215	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	70- 71
1216	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	72- 73
35 1217	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	110-111
1218	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	165-166
1219	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	112-113
1220	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
40				83- 86
1221	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>		tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
45 1222	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cyclohexanimino	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	91- 94
1223	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-N=C(cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	70- 75
50 1224	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Tetrahydrofuran-3-yl	104-106
1225	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Succinimido	Tetrahydrofuran-3-yl	160-162

	Nr.	R1 -	R5	R4	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5	1226	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Tetrahydrofur-3-yl	δ1 1.33(d;6H), 2.40(m;2H), 3.75(sept;1H), 4.00(m;4H), 4.75 (m;1H), 8.25 (d;1H, NH)
10					
15	1227	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	134-135
	1228	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Succinimido	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	146-148
	1229	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Thiazol-2-yl	195
20	1230	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	5-Methyl-thiazol- 2-yl	248
	1231	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	5-Ethyl-thiazol- 2-yl	228-230
25	1232	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	5-n-Propyl-thiazol- 2-yl	160-163
	1233	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Succinimido	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	141-144
	1234	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	cyclo-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	95- 96
30	1235	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	100-101
	1236	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	129-131
	1237	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	163-165
	1238	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Piperidino	167-168
	1239	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Morpholino	177-179
35	1240	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	62- 65
	1241	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Cyclopropylmethyl	88- 90
	1242	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	δ1; 1.00(t;3H), 1.34(d;3H), 1.37(d;6H), 1.66(quint;2H), 3.78 (sept;1H), 4.17(m;1H), 7.04 (d,1H, NH)
40	1243	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	δ1; 0.98 (t;3H), 1.26 (d,3H), 1.39 (d,6H) 1.64 (quint; 2H), 2.16 und 2.18 (2s; 6H) 3.44 (sept;1H), 4.10 (m,1H), 8.54 (d,1H, NH)
45					
50					
55					

Nr.	R1	R3	R4	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]	
5					
1244	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	Gemisch aus 4-Methyl-5-carboxy- thiazol-2-yl und 4-Methyl-thiazol-2-yl	197	
10					
1245	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub> -CH=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	59- 63	
1246	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	143-145	
1247	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	67- 71	
15	1248	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub> -CCl <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	72- 75
1249	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-NHCOCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	212-214	
1250	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	140-141	
1251	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cyclooctanimino	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	ö1, 1,37(d,6H), 1,47(s;9H), 1,28-1,93	
20				(m;10H), 2,54	
				(m;4H), 3,44	
				(sept,1H), 8,44	
25				(bs;1H,NH)	
1252	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	ö1, 1,34(d;6H), 1,47 (s;9H), 3,39 (s;3H), 3,45 (sept;1H), 3,60 (m;4H), 3,84 und 4,50	
30				(m;4H), 8,94	
				(bs;1H,NH)	
35					
1253	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	46- 48	
1254	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Pyrid-2-yl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	155-163	
40	1255	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -Cl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	70- 72
1263	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	CH <sub>3</sub>	146-149	
1264	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	60- 63	
1265	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	112-114	
45	1266	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	145-150

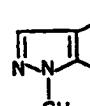
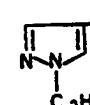
50

55

Nr.	R1	R5	R4	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5	1267	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> 52- 54
	1268	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> 58- 62
	1269	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ö1 0,92 (t;3H), 1,43 (m,2H), 1,48(s;9H), 1,74(m;2H) 3,00(t;2H), 5,01(s;2H), 8,80(bs;1H;NH)
10				
	1270	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	2,6-Br <sub>2</sub> -4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> 165-170
	1271	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ö1 0,92(t;3H), 1,41(m;2H), 1,46(s;9H), 1,66(m;2H), 2,89(t;2H), 4,88(d;2H), 5,40(m;2H), 6,01(m;1H), 9,19(bs;1H,NH)
15				
	1272	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	2,4-Dichlorbenzyl	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> 81- 86
	1273	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	Cyclopropylmethyl 65- 70
20	1274	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ö1 0,92 (t,3H), 1,34(d,3H), 1,39(d;6H), 1,76(m;2H), 3,65(m;1H), 4,32(m;1H), 7,08 (bs;1H,NH)
25				
	1275	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> 80 - 84
	1276	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> 78- 85
30	40	1277	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ö1 0,70(m,;2H), 0,90 (m;2H), 0,92 (t;3H), 1,34 (d;3H), 1,79 (m;2H), 2,14 und 2,18 (2s;6H), 2,97 (m;1H), 3,24 (m;1H), 8,80 (bs,1H,NH)
35				
40				
45				
50				

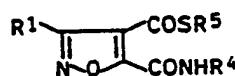
	Nr.	R1	R5	R4	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5	1278	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Succinimido	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	112-115
	1279	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	93- 95
10	1280	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	ö1 0,92 (t,3H), 1,34 (d;3H), 1,48 (s;9H), 1,80 (m;2H), 2,12 und 2,16 (2s;6H), 3,26 (m,1H), 8,29 (bs,1H,NH)
15	1281	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	117-120
20	1282	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	ö1, 0,93(t;3H), 1,36 (d;3H), 1,80 (m;2H), 2,14 und 2,18 (2s;6H), 3,28 (m;1H), 7,10-7,80(m;5H) 10,90(bs;1H),NH)
25	1283	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Succinimido	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	137-140
30	1284	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Succinimido	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	238-242
	1285	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Succinimido	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	144-146
	1286	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	86- 90
35	1287	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	75- 77
	1288	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	93- 98
	1290	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	CH <sub>3</sub>	130-133
	1291	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	100-104
	1292	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	133-136
40	1293	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	56- 62
	1294	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	112-117
	1295	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	107-111
	1296	neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	205-207
45	1297	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	Succinimido	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	131-133
	1298	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	Succinimido	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	167-168
	1299	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	Succinimido	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	168-170
	1300	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	139-140
50	1301	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	ö1 0,80 (m;8H), 2,02 und 2,04 (2s; 6H), 2,30 (m;1H), 2,86 (m;1H), 9,20 (d;1H,NH)

Nr.	R <sub>1</sub>	R <sub>5</sub>	R <sub>4</sub>	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
5				
1302	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	-N=C(cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	106-108
10	1303	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>
	1304	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>
	1305	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
	1306	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>
15	1307	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>
	1308	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
	1309	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	1310	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
20	1311	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1312	Tetrahydro- pyran-3-yl	Succinimido	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
	1313	2-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1314	2-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	cyclo-C <sub>4</sub> H <sub>5</sub>
25	1315	2,6F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1316	2,6F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>
	1317	CH <sub>3</sub> -O-	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
30	1318	CH <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1319	CH <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub>	H	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>
	1320	CH <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
35	1321	CH <sub>3</sub> -O-CH(CH <sub>3</sub> )-	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
40				95-100
	1318	CH <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub>	H	90- 95
	1319	CH <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub>	H	65- 70
	1320	CH <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	δ1 1,45 (s;9H)
45	1321	CH <sub>3</sub> -O-CH(CH <sub>3</sub> )-	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1,60 (d;3H), 2,16 und 2,18 (2s;6H), 3,34 (s;3H), 4,87 (quart.; 1H) 8,10(bs;1H,NH)
	1322	CH <sub>3</sub> -O-CH(CH <sub>3</sub> )-	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
50	1323	CH <sub>3</sub> -O-CH(CH <sub>3</sub> )-	2,6-Br <sub>2</sub> -4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	1324	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
55				δ1 1,46 (s;9H) 2,54 (s;3H) 3,82 (s;3H), 5,40(quart.;1H) 9,00(bs;1H,NH)

Nr.	R1	R5	R4	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]	
5	1325	CH <sub>3</sub>	2,6-Br <sub>2</sub> -4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	143-146
10	1326		H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	168-170
15	1327		H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	157
20	1328		H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	254
25	1329		CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	δ <sub>1</sub> , 1, 5 (s, 9H), 3, 8 (s; 3H), 3, 9 (s; 3H), 6, 5 (d; 1H), 7, 6 (d; 1H), 8, 7 (bs, 1H, NH)
30	1330		CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	120-122°C
35	1331		CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	δ <sub>1</sub> , 1, 5 (s; 9H), 3, 7 (s; 3H), 3, 8 (s; 3H), 3, 9 (s; 3H), 8, 0 (s; 1H), 9, 2 (bs, 1H, NH)
40	1332		H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
45	1333		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
50	1334		H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
55	1335		-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	

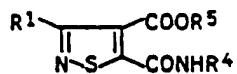
Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>4</sup>	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
1336	Pyrid-2-yl	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1337	Pyrid-2-yl	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1338	Pyrid-3-yl	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1339	Pyrid-3-yl	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1340	Pyrid-4-yl	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1341	Pyrid-4-yl	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1342	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1343	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1344	CH <sub>3</sub>	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1345	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1346	CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1347	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1348	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1349	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1350	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
1351	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cyclopentanimino	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	113-115

Tabelle 2



Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>4</sup>	Fp [°C]/ <sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
2001	CH <sub>3</sub>	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
2002	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
2003	CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	ö1; 1,46 (s; 9H), 1,60 (s; 9H), 2,50 (s; 3H), 7,94 (bs; 1H, NH)
2004	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
2005	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
2006	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
2007	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	

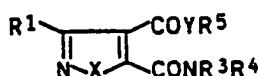
5 Tabelle 3



	Nr.	R1	R5	R4	Fp [°C]/H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]
10	3001	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	153-154
	3002	CH <sub>3</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	158-159
15	3003	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	178-183
	3004	CH <sub>3</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	231
	3005	CH <sub>3</sub>	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	221-223
	3006	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	138-140
20	3007	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	55- 56
	3008	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	155-157
	3009	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	39
	3010	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	164
	3011	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	130-131
25	3012	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	202-204
	3013	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	158-159
	3014	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	191-195
	3015	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	84
30	3016	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	160-162
	3017	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	90- 91
	3018	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	178-179
	3019	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	38- 41
35	3020	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	171-172
	3021	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	92- 93
	3022	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	185-186
	3023	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	92- 93
40	3024	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	177-179
	3025	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	37- 45
	3026	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	144
	3027	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	98-100
	3028	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	209
45	3029	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	130-131
	3030	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	204
	3031	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	100-101
	3032	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	209
50	3033	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	157-158
	3034	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	217
	3035	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	131-132
	3036	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Succinimido	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	98-100
55	3037	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Succinimido	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	75- 76

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>4</sup>	Fp [°C]/H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) [ppm]	
5					
3038	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Na <sup>⊕</sup>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	300	
3039	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	K <sup>⊕</sup>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	110	
3040	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Na <sup>⊕</sup>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	330	
10	3041	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	K <sup>⊕</sup>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	300
3042	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H <sub>3</sub> N-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	154-157	
15	3043	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H <sub>3</sub> N-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -OH	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	162-164
3044	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Succinimido	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	161	
3045	CH <sub>3</sub>	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	97- 98	

20 Analog können darüber hinaus beispielsweise weitere Verbindungen hergestellt werden mit der allgemeinen Struktur



25

wobei für X und Y Sauerstoff oder Schwefel, und beispielsweise  
 R<sup>1</sup> für einen Rest aus der Gruppe Q1 bis Q61,  
 R<sup>5</sup> für einen Rest aus der Gruppe M1 bis M78,  
 30 R<sup>3</sup> für einen Rest aus der Gruppe P<sub>1</sub>-P<sub>11</sub>,  
 R<sup>4</sup> für einen Rest aus der Gruppe L1 bis L195 stehen und  
 die Reste X, Y, P, Q, M und L beliebig kombiniert werden können.  
 R<sup>1</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> können beispielsweise die folgenden Reste bedeuten:

35

Verb.	R <sup>1</sup>	Verb.	R <sup>1</sup>
Nr.		Nr.	
40	Q1 H	Q24	Tetrahydropyran-3-yl
Q2 CH <sub>3</sub>		Q25	Tetrahydropyran-3-yl
Q3 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		Q26	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
Q4 n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>		Q27	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
45	Q5 i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Q28	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q6 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		Q29	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q7 i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		Q30	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q8 s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		Q31	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
50	Q9 tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Q32	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q10 cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>		Q33	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q11 cyclo-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>		Q34	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q12 cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>		Q35	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
55	Q13 cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Q36	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q14 cyclo-C <sub>7</sub> H <sub>13</sub>			

Verb.	R <sup>1</sup>	Verb.	R <sup>1</sup>
Nr.		Nr.	
5	Q15— <i>cyclo-C<sub>8</sub>H<sub>15</sub></i>	Q37	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	Q16 CF <sub>3</sub>	Q38	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	Q17 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Q39	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10	Q18 CH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	Q40	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	Q19 CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Q41	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	Q20 CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Q42	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	Q21 Tetrahydrofur-2-yl	Q43	4-SCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
		Q44	4-SCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
15	Q22 Tetrahydrofur-2-yl	Q45	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
		Q46	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	Q23 Tetrahydrofur-2-yl		
	Q47 neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Q56	
20	Q48 CH <sub>3</sub> O		
	Q49 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> O		
	Q50 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -CH <sub>2</sub>	Q57	
25	Q51 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub>		
	Q51 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> -		
30	Q52	Q58	
	Q53	Q59	Pyrid-2-yl
35	Q54	Q60	Pyrid-3-yl
		Q61	Pyrid-4-yl
		Q62	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
40	Q55		

45

50

55

	Verb.	R <sup>5</sup>
	Nr.	
5		
	M1	H
	M2	CH <sub>3</sub>
10	M3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	M4	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	M5	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	M6	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
15	M7	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	M8	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	M9	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>
	M10	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
20	M11	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	M12	Succinimido
	M13	Li <sup>⊕</sup>
	M14	Na <sup>⊕</sup>
25	M15	K <sup>⊕</sup>
	M16	NH <sub>4</sub> <sup>⊕</sup>
	M17	H <sub>3</sub> N <sup>⊕</sup> i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	M18	H <sub>2</sub> N <sup>⊕</sup> (i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>
30	M19	H <sub>3</sub> N <sup>⊕</sup> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH
	M20	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
	M21	CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>
	M22	CH <sub>2</sub> -C(C <sub>1</sub> )=CH <sub>2</sub>
35	M23	CH <sub>2</sub> -C≡CH
	M24	CH <sub>2</sub> -C≡C-CH <sub>2</sub> OH
	M25	-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
	M26	-N=C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
40	M27	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
	M28	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
	M29	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> N <sup>⊕</sup> (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> I <sup>⊖</sup>
	M30	CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>
45	M31	Phenyl
	M32	Phenylethyl
	M33	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
	M34	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -ON=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
50	M35	CH <sub>2</sub> -PO(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
	M36	CH(CH <sub>3</sub> )CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
	M37	CH <sub>2</sub> -CON(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
	M38	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
55	M39	CH <sub>2</sub> -OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>

Verb.	R5
5	
	M40 $\text{CH}(\text{COOCH}_3)_2$
	M41 $-\text{N}=\text{C}(\text{cyclo-C}_3\text{H}_5)_2$
10	
	M42 $\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{N}=\text{C} \\   \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$
15	
	M43 Cyclohexanimino
	M44 Cyclooctanimino
	M45 $\text{CH}_2\text{--CH}_2\text{--Cl}$
	M46 $\text{CH}_2=\text{CH}_2\text{--CN}$
20	
	M47 $\text{CH}_2\text{--CCl}_3$
	M48 Pyrid-3-ylmethyl
	M49 Thien-2-yl-methyl
25	
	M50 $\begin{array}{c} -\text{CH}_2\text{--CH} \text{---} \text{O} \text{---} \text{CH}_3 \\   \\ \text{CH}_2\text{---O} \text{---} \text{X} \end{array}$
30	
	M51 $\begin{array}{c} -\text{CH}_2\text{---CH} \text{---} \text{OH} \\   \\ \text{CH}_2\text{---OH} \end{array}$
35	
	M52 $\begin{array}{c} -\text{CH}_2\text{---CH} \text{---} \text{O} \\   \\ \text{CH}_2\text{---O} \text{---} \text{O} \end{array}$
	M53 $-\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)\text{COOCH}_3$
40	
	M54 cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>
	M55 $-\text{CH}_2\text{---OCH}_2\text{---C}_6\text{H}_5$
	M56 Tetrahydropyran-2-yl
	M57 Tetrahydrofur-2-yl
45	
	M58 (4-Brom-benzoyl)methyl
	M59 (4-Methoxybenzoyl)methyl
	M60 $-\text{CH}(\text{COOCH}_3)_2$
	M61 Phthalimidomethyl
	M62 Fur-2-ylmethyl
	M63 Tetrahydrofur-2-yl-methyl
	M64 Pyrid-2-ylmethyl
	M65 Pyrid-4-ylmethyl
50	
	M66 Pyrid-3-yl-methyl
	M67 Thien-2-yl-methyl
	M68 $-\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)\text{COOCH}_3$
	M69 Piperidino
55	
	M70 Phthalimido

	Verb.	R <sup>5</sup>
	Nr.	
5		
	M71	
10	M72	-N=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
	M73	
15	M74	2-NO <sub>2</sub> -4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	M75	3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	M76	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>
	M77	4-NHCOCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
20	M78	2, 4-Dichlorobenzyl

	Verb.	R <sup>3</sup>	Verb.	R <sup>3</sup>
	Nr.		Nr.	
25	P1	H	P12	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	P2	CH <sub>3</sub>	P13	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
	P3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	P14	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>
30	P4	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	P15	CH <sub>2</sub> SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	P5	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	P16	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>
	P6	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	P17	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
	P7	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	P18	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
35	P8	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	P19	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>
	P9	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> OH	P20	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>
	P10	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> Cl	P21	1-Methyl-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>10</sub>
40	P11	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>		

45

50

55

	Verb.	R <sup>4</sup>	Verb.	R <sup>4</sup>
	Nr.		Nr.	
5	L1	- H	L21	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>
	L2	CH <sub>3</sub>	L22	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
	L3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	L23	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>
	L4	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	L24	cyclo-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>
10	L5	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	L25	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>
	L6	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	L26	cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>
	L7	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	L27	cyclo-C <sub>7</sub> H <sub>13</sub>
	L8	sec-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	L28	cyclo-C <sub>8</sub> H <sub>15</sub>
15	L9	tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	L29	1-Methylcyclohexyl
	L10	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	L30	1-Ethylcyclohexyl
	L11	-CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	L31	3, 5-Dimethylcyclohexyl
	L12	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	L32	3-Trifluormethylcyclohexyl
20	L13	n-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	L33	Tetrahydropyran-4-yl
	L14	-CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	L34	4-Methyl-tetrahydropyran
	L15	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>		
	L16	n-C <sub>7</sub> H <sub>15</sub>		
25	L17	-CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>		
	L18	-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>		
	L19	n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>		
	L20	-CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>		

30

35

40

45

50

55

Verb.	R <sup>4</sup>	Verb.	R <sup>4</sup>
Nr.		Nr.	
5	L35 4-Methyl-tetrahydropyran-4-yl	L72 -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	
10	L36 -CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	L73 -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
15	L37 -CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	L75 2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
20	L38 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	L76 3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
25	L39 -C(CH <sub>3</sub> , C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	L77 4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
30	L40 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	L78 2-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
35	L41 -C(CH <sub>3</sub> , C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	L79 3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
40	L42 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	L80 4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
45	L43 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> cycloC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	L81 3-tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
50	L44 -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	L82 4-tert.-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L45 -CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>3</sub>	L83 2, 3-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	
	L46 -CH(CH <sub>3</sub> )CH=CHCH <sub>3</sub>	L84 2, 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	
	L47 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>3</sub>	L85 2, 5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	
	L48 -CH <sub>2</sub> C≡CH	L86 2, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	
	L49 -CH(CH <sub>3</sub> )C≡CH	L87 3, 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	
	L50 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C≡CH	L88 3, 5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	
	L51 -C(CH <sub>3</sub> , C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )C≡CH	L89 2, 3, 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	
	L52 -C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> C≡CH	L90 2, 3, 5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	
	L53 -CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	L91 2, 4, 5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	
	L54 -CH(CH <sub>3</sub> )C≡CCH <sub>3</sub>	L92 2, 4, 6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	
	L55 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	L93 3, 4, 5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	
	L56 -CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	L94 2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L57 -CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	L95 3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L58 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	L96 4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L59 -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	L97 2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L60 -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	L98 3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L61 -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	L99 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L62 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	L100 2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L63 -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	L101 3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L64 -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	L102 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L65 -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> Cl	L103 2-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L66 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	L104 3-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L67 -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	L105 4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
	L68 -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	L106 2, 3-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	
	L69 -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	L107 2, 4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	
	L70 -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	L108 2, 5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	
	L71 -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	L109 2, 6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	
		L110 2, 3-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	

	Verb. Nr.	R <sup>4</sup>	Verb. Nr.	R <sup>4</sup>
5	L111	2,4-C12-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	L149	3-SCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L112	2,5-C12-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	L150	4-SCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L113	2,6-C12-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	L151	2-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L114	3,4-C12-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	L152	3-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
10	L115	3,5-C12-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	L153	4-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L116	2,3,4-C13-C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	L154	2-S-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L117	2,3,5-C13-C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	L155	3-S-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L118	2,4,6-C13-C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	L156	4-S-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
15	L119	3,4,5-C13-C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	L157	2,4-(SCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	L120	2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L158	2-SCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L121	3-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L159	3-SCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L122	4-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L160	4-SCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
20	L123	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L161	2-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L124	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L162	3-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L125	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L163	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L126	2-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L164	2,3-(NO <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
25	L127	3-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L165	2,4-(NO <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	L128	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L166	2,5-(NO <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	L129	2-O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L167	2,6-(NO <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	L130	3-O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L168	3,4-(NO <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
30	L131	4-O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L169	3,5-(NO <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
	L132	2-O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L170	2-CHO-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L133	3-O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L171	3-CHO-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
	L134	4-O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L172	4-CHO-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
35	L135	2,3-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	L173	2-C <sub>2</sub> H <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
	L136	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>		
	L137	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	L174	3-C <sub>2</sub> H <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
40	L138	2,6-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>		
	L139	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	L175	4-C <sub>2</sub> H <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
	L140	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>		
	L141	3,4,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>		
45	L142	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L176	2-CC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
	L143	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>		
	L144	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>		
50	L145	2-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L177	3-CC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
	L146	3-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>		
	L147	4-OCF <sub>3</sub> CHF <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	L178	4-CC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
55	L148	2-SCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>		

	Verb.	R <sup>4</sup>
5	Nr.	
	L179	2-C-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
10	L180	3-C-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
15	L181	4-C-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
20	L182	2-CCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
25	L183	3-CCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
30	L184	4-CCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>    O
	L185	1-Naphthyl
	L186	2-Naphthyl
	L187	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
	L188	Piperidino
	L189	Tetrahydrofur-3-yl
35	L190	Thiazol-2-yl
	L191	5-Methyl-thiazol-2-yl
	L192	5-Ethyl-thiazol-2-yl
	L193	5-n-Propyl-thiazol-2-yl
40	L194	4-Methyl-5-carboxy-thiazol-2-yl
	L195	Cyclopropylmethyl

Die Verbindungen la bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, ölichen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfundungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die Verbindungen la eignen sich allgemein zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen aus Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner aus Kohlenteerölen sowie aus Ölen pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, oder stark polare Lösungsmittel, wie N,N-Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Dispersionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung

von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

5 Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali- und Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutylnaphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkyaryl sulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen, sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenol-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Ricinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin, Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

10 15 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

20 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talcum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreide- mehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

25 Beispiele für solche Zubereitungen sind:

I. Man vermischt 90 Gew.-Teile der Verbindung Nr. 1006 mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- $\alpha$ -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinstter Tropfen geeignet ist.

II. 20 Gew.-Teile der Verbindung Nr. 1006 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gew.-Teilen Xylool, 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes und 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in Wasser erhält man eine wässrige Dispersion.

III. 20 Gew.-Teile der Verbindung Nr. 1022 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

IV. 20 Gew.-Teile der Verbindung Nr. 1049 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gew.-Teilen Cyclohexanol, 65 Gew.-Teilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280 °C und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

V. 20 Gew.-Teile des Wirkstoffs Nr. 3038 werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- $\alpha$ -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfitablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kiesel säuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

VI. 3 Gew.-Teile der Verbindung Nr. 1075 werden mit 97 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

VII. 30 Gew.-Teile des Wirkstoffs Nr. 1220 werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kiesel säuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kiesel säuregels gesprührt wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit.

VIII. 20 Gew.-Teile des Wirkstoffs Nr. 1026 werden mit 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gew.-Teilen Fettalkoholpolyglykolether, 2 Gew.-Teilen Natriumsalz eines Phenol-Formaldehyd-Kondensats und 68 Gew.-Teilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.

Die Formulierungen enthalten zwischen 0,1 und 95 Gew.%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.%, Wirkstoff.

Die Applikation der herbiziden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauflauf- oder vorzugsweise im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 5, vorzugsweise 0,01 bis 1 kg/ha.

In Anbetracht des erfaßbaren Wirkungsspektrums zur Bekämpfung der unerwünschten Pflanzen der 10 Verträglichkeit für Kulturpflanzen oder der erwünschten Beeinflussung des Wachstums derselben sowie angesichts der Vielfalt der Applikationsmethoden können die Verbindungen der Formel Ia sowie die sie enthaltenden herbiziden Mittel in einer großen Zahl von Kulturpflanzen eingesetzt werden.

In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

15

20

25

30

35

40

45

50

55

	Botanischer Name	Deutscher Name
	<i>Allium cepa</i>	Küchenzwiebel
	<i>Ananas comosus</i>	Ananas
5	<i>Arachis hypogaea</i>	Erdnuß
	<i>Asparagus officinalis</i>	Spargel
	<i>Avena sativa</i>	Hafer
	<i>Beta vulgaris</i> spp. <i>altissima</i>	Zuckerrübe
10	<i>Beta vulgaris</i> spp. <i>rapa</i>	Futterrübe
	<i>Beta vulgaris</i> spp. <i>esculenta</i>	Rote Rübe
	<i>Brassica napus</i> var. <i>napus</i>	Raps
	<i>Brassica napus</i> var. <i>napobrassica</i>	Kohlrübe
15	<i>Brassica napus</i> var. <i>rapa</i>	Weiße Rübe
	<i>Brassica rapa</i> var. <i>silvestris</i>	Rübsen
	<i>Camellia sinensis</i>	Teestrauch
	<i>Carthamus tinctorius</i>	Saflor - Färberdistel
20	<i>Carya illinoiensis</i>	Pekannußbaum
	<i>Citrus limon</i>	Zitrone
	<i>Citrus maxima</i>	Pampelmuse
	<i>Citrus reticulata</i>	Mandarine
25	<i>Citrus sinensis</i>	Apfelsine, Orange
	<i>Coffea arabica</i> ( <i>Coffea canephora</i> , <i>Coffea liberica</i> )	Kaffee
	<i>Cucumis melo</i>	Melone
30	<i>Cucumis sativus</i>	Gurke
	<i>Cynodon dactylon</i>	Bermudagrass
	<i>Elaeis guineensis</i>	Ölpalme
	<i>Fragaria vesca</i>	Erdbeere
35	<i>Glycine max</i>	Sojabohne
	<i>Gossypium hirsutum</i> ( <i>Gossypium arboreum</i> , <i>Gossypium herbaceum</i> , <i>Gossypium vitifolium</i> )	Baumwolle
	<i>Helianthus annuus</i>	Sonnenblume
40	<i>Helianthus tuberosus</i>	Topinambur
	<i>Hevea brasiliensis</i>	Parakautschukbaum
	<i>Hordeum vulgare</i>	Gerste
	<i>Humulus lupulus</i>	Hopfen
45	<i>Ipomoea batatas</i>	Süßkartoffeln
	<i>Juglans regia</i>	Walnußbaum

	Botanischer Name	Deutscher Name
	<i>Lactua sativa</i>	Kopfsalat
5	<i>Lens culinaris</i>	Linse
	<i>Linum usitatissimum</i>	Faserlein
	<i>Lycopersicon lycopersicum</i>	Tomate
	<i>Malus spp.</i>	Apfel
10	<i>Manihot esculenta</i>	Maniok
	<i>Medicago sativa</i>	Luzerne
	<i>Mentha piperita</i>	Pfefferminze
	<i>Musa spp.</i>	Obst- und Mehlbanane
15	<i>Nicotiana tabacum (N. rustica)</i>	Tabak
	<i>Olea europaea</i>	Ölbaum
	<i>Oryza sativa</i>	Reis
	<i>Panicum miliaceum</i>	Rispenhirse
20	<i>Phaseolus lunatus</i>	Mondbohne
	<i>Phaseolus mungo</i>	Erdbohne
	<i>Phaseolus vulgaris</i>	Buschbohnen
	<i>Pennisetum glaucum</i>	Perl- oder Rohrkolbenhirse
25	<i>Petroselinum crispum spp. tuberosum</i>	Wurzelpetersilie
	<i>Picea abies</i>	Rotfichte
	<i>Abies alba</i>	Weißtanne
	<i>Pinus spp.</i>	Kiefer
30	<i>Pisum sativum</i>	Gartenerbse
	<i>Prunus avium</i>	Süßkirsche
	<i>Prunus domestica</i>	Pflaume
	<i>Prunus dulcis</i>	Mandelbaum
35	<i>Prunus persica</i>	Pfirsich
	<i>Pyrus communis</i>	Birne
	<i>Ribes sylvestre</i>	Rote Johannisbeere
	<i>Ribes uva-crispa</i>	Stachelbeere
40	<i>Ricinus communis</i>	Rizinus
	<i>Saccharum officinarum</i>	Zuckerrohr
	<i>Secale cereale</i>	Roggen
	<i>Sesamum indicum</i>	Sesam
	<i>Solanum tuberosum</i>	Kartoffel
45	<i>Sorghum bicolor (s. vulgare)</i>	Mohrenhirse
	<i>Sorghum dochna</i>	Zuckerhirse
	<i>Spinacia oleracea</i>	Spinat
	<i>Theobroma cacao</i>	Kakaobaum
50	<i>Trifolium pratense</i>	Rotklee
	<i>Triticum aestivum</i>	Weizen
	<i>Triticum durum</i>	Hartweizen
	<i>Vaccinium corymbosum</i>	Kulturheidelbeere
55	<i>Vaccinium vitis-idaea</i>	Preißelbeere

	<u>Botanischer Name</u>	<u>Deutscher Name</u>
5	<i>Vicia faba</i>	Pferdebohnen
	<i>Vigna sinensis</i> (v. <i>unguiculata</i> )	Kuhbohne
	<i>Vitis vinifera</i>	Weinrebe
	<i>Zea mays</i>	Mais

10 Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die Isoxazol-(Isothiazol)-5-carbonsäureamide der Formel Ia mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner Diazine, 4H-3,1-Benzoazinderivate, Benzothiadiazinone, 2,6-Dinitroaniline, N-  
15 Phenylcarbamate, Thiolcarbamate, Halogencarbonsäuren, Triazine, Amide, Harnstoffe, Diphenylether, Triazinone, Uracile, Benzofuranderivate, Cyclohexan-1,3-dionderivate, Chinolincarbonsäuren, Sulfonylharnstoffe, Imidazolinone, (Hetero)Aryloxyphenoxypropionsäuren, deren Salze, Ester und Amide und andere Wirkstoffe in Betracht.

20 Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen der Formel Ia allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt gemeinsam zubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopatogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate hergestellt werden.

25

#### Anwendungsbeispiele

30 Die Wirkung der Isoxazol-(Isothiazol)-5-carbonsäureamide der Formel Ia auf das Pflanzenwachstum lässt sich durch Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienen Plastikblumentöpfe mit 300 cm<sup>3</sup> Inhalt und lehmigem Sand mit etwa 3 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen werden nach Arten getrennt flach eingesät.

35 Bei Vorauflaufbehandlung werden die aufbereiteten Wirkstoffe unmittelbar danach auf die Erdoberfläche aufgebracht. Sie werden hierzu in Wasser als Verteilungsmittel suspendiert oder emulgiert und mittels fein verteilender Düsen gespritzt. Nach dem Aufbringen der Mittel werden die Gefäße leicht beregnet, um Keimung und Wachstum in Gang zu bringen. Danach deckt man die Gefäße mit durchsichtigen Plastikhüften ab, bis die Pflanzen auflaufen. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wird.

40 Zum Zwecke der Nachlaufbehandlung werden entweder direkt gesäte oder in den gleichen Gefäßen aufgewachsene Pflanzen ausgewählt oder die Pflanzen werden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt.

45 Je nach Wuchsform werden die Testpflanzen bei einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm dann mit den in Wasser als Verteilungsmittel suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen, die durch fein verteilende Düsen gespritzt werden, behandelt. Die Aufwandmenge für die Nachlaufbehandlung beträgt 1,0 und 3,0 kg/ha a.S.

50 Die Versuchsgefäße werden dann im Gewächshaus aufgestellt, wobei für wärmeliebende Arten wärmerre Bereiche (20 bis 35 °C) und für solche gemäßigter Klimate 10 bis 20 °C bevorzugt werden. Die Versuchsperiode erstreckt sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit werden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wird ausgewertet.

55 Bewertet wird nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzen sich aus folgenden Arten zusammen:

	Lateinischer Name	Deutscher Name
5	Abutilon theophrasti	Chinesischer Hanf
	Centaurea cyanus	Kornblume
	Chenopodium album	Wei�er G�nsefu�
	Chrysanthemum coronarium	Kranenwucherblume
	Echinochloa crus-galli	H�hnerhirse
	Galium aparine	Klettenlabkraut
10	Ipomoea spp.	Prunkwindearten
	Lolium multiflorum	Ital. Raygras
	Mentha piperita	Pfefferminze
	Mercurialis annua	einj. Bingelkraut
	Solanum nigrum	Schwarzer Nachtschatten
	Triticum aestivum	Sommerweizen
15	Viola spp.	Stiefm�tterchen
	Zea mays	Mais

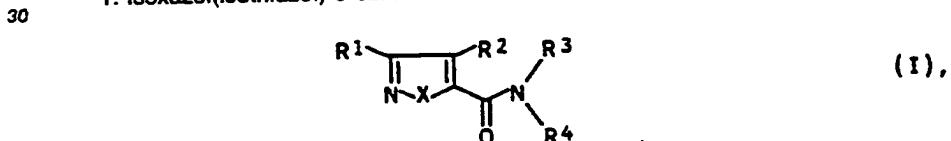
Der beispielhaft ausgewh lte Wirkstoff Nr. 1006 bek mpft unerw nschte Pflanzen im Vorauflaufverfahren bei einer Aufwandmenge von 3,0 kg/ha sehr gut.

20 Bei Nachauflaufanwendung zeigen u.a. die Wirkstoffe Nr. 1004, 1014, 3018, 1026, 1006, 1049 und 1022 bei 1 bis 3 kg/ha Aufwandmenge herbizide Wirkung gegen ein breites Spektrum unerw nschter Pflanzen. Außerdem zeigen die Verbindungen Nr. 1075 und 3038 eine sehr gute herbizide Wirkung an breitbl ttrigen Pflanzen bei gleichzeitiger Selektivit t in Mais. Die Verbindung Nr. 1211 zeigt neben ausgezeichneter herbizider Aktivit t Selektivit t in Weizen.

25

### Anspr che

#### 1. Isoxazol(Isothiazol)-5-carbons ureamide der Formel



in der

X Sauerstoff oder Schwefel,

R<sup>1</sup> Wasserstoff,

40 gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkoxy, Halogen, Cyano oder Phenyl, das durch Halogenen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Cyano oder Nitro substituiert sein kann, substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,

45 gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, einen 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewh lt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, der durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Carboxyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl substituiert sein kann,

oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl,

50 R<sup>2</sup> Formyl, 4,5-Dihydro-oxazol-2-yl oder einen Rest der Formel COYR<sup>5</sup> oder CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>,

wobei

Y f r Sauerstoff oder Schwefel,

R<sup>5</sup> f r Wasserstoff,

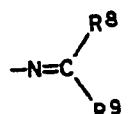
55 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, das durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, Halogen, Cyano, Hydroxy, Trimethylsilyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl, Carboxyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkoxyphosphonyl, Alkaniminoxy, Benzyloxy, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy oder Halogen substituiertes Benzoyl oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl,

durch Thienyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Phthalimido oder Pyridyl substituiert sein kann, gegebenenfalls durch Phenyl, das durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro oder Cyano substituiert sein kann, substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl,

5 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl,  
gegebenenfalls durch Hydroxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl,  
C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl,  
gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkox-  
10 ycarbonyl oder Acylamino substituiertes Phenyl,  
einen 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der  
Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, oder einen Benzotriazolrest  
C<sub>6</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkanimino, Phthalimido, Succinimido, für die Reste



-CH<sub>2</sub>-CH(OH)-CH<sub>2</sub>(OH),  
20 für ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali-, Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen,  
Ammonium und substituiertes Ammonium oder für den Rest



wobei R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> unabhängig voneinander C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Phenyl, Furyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- mit m = 4 bis 7 Kettengliedern bedeuten und R<sup>9</sup> <sup>11</sup> auch Wasserstoff bedeuten.

30 zusätzlich Wasserstoff bedeutet,  
 $R^6$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl oder  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl und  
 $R^7$  für Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl stehen oder wobei  
 $R^6$  und  $R^7$  eine Methylenkette mit 4 oder 5 Gliedern bilden,  
 $R^3$  Wasserstoff,  
35 gegebenenfalls durch Hydroxy, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio oder  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino substituiertes  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl  
oder gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl substituiertes  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl  
und  
 $R^4$  Wasserstoff, Hydroxyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  
40 gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino, Halogen,  
 $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl oder Phenyl, das durch Halogen, Cyano, Nitro,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -  
Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio substituiert sein kann, substituiertes  
 $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  
gegebenenfalls durch Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy substituiertes  $C_3$ - $C_{10}$ -Alkenyl oder  $C_3$ - $C_{10}$ -Alkinyl,  
45 gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -  
Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylthio, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl,  
 $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino,  
einen gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl oder Halogen substituierten 3- bis 6-gliedrigen  
heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel  
50 und gegebenenfalls durch Methyl substituierter Stickstoff, Naphthyl,  
oder gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -  
Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkanoyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalka-  
noyl substituiertes Phenyl bedeuten  
oder  
55  $R^3$  und  $R^4$  gemeinsam einen Rest der Struktur  $-(CH_2)_n-Y_p-(CH_2)_q-$ , wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0  
oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten, oder den Rest der Formel  
 $-(CH_2)_3-CO-$   
bilden,

sowie deren umweltverträglichen Salze

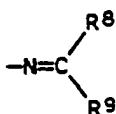
mit der Maßgabe, daß X Schwefel ist, wenn R<sup>1</sup> CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> COOH oder COOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub> und R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeuten, und daß X Sauerstoff ist, wenn R<sup>1</sup> Wasserstoff, R<sup>2</sup> COOH oder CONH<sub>2</sub> und R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeuten.

5 2. Isoxazol(Isothioazol)-5-carbonsäureamide der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R<sup>3</sup> Wasserstoff bedeutet.

3. Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamide der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

R<sup>1</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,

10 R<sup>2</sup> COYR<sup>5</sup>, wobei Y für Sauerstoff oder Schwefel und R<sup>5</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder Halogen substituiertes Phenyl oder den Rest



20 stehen,

R<sup>3</sup> Wasserstoff und

R<sup>4</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl bedeuten.

4. Isoxazol-5-carbonsäureamid der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R<sup>1</sup> n-Propyl, R<sup>2</sup> Propan-2-iminoxcarbonyl, R<sup>3</sup> Wasserstoff und R<sup>4</sup> tert.-Butyl bedeuten.

25 5. Herbizides Mittel, enthaltend ein Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamid der Formel



in der

X Sauerstoff oder Schwefel,

R<sup>1</sup> Wasserstoff,

35 gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkoxy, Halogen, Cyano oder Phenyl, das durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, Cyano oder Nitro substituiert sein kann, substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,

40 gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, einen 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, der durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Carboxyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyxcarbonyl substituiert sein kann,

oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl,

45 R<sup>2</sup> Formyl, 4,5-Dihydro-oxazol-2-yl oder einen Rest der Formel COYR<sup>5</sup> oder CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> wobei

Y für Sauerstoff oder Schwefel,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff,

50 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, das durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, Halogen, Cyano, Hydroxy, Trimethylsilyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl, Carboxyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyxcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkoxyphosphonyl, Alkaniminoxy, Benzyloxy, gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy oder Halogen substituiertes Benzoyl oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, durch Thienyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Phthalimido oder Pyridyl substituiert sein kann,

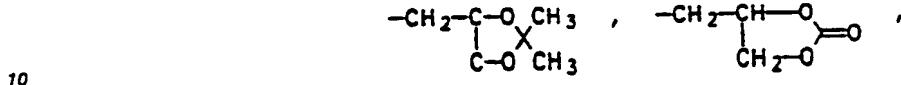
55 gegebenenfalls durch Phenyl, das durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Halogen, Nitro oder Cyano substituiert sein kann, substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl,

C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl,

gegebenenfalls durch Hydroxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl,

$C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  
 $C_5$ - $C_6$ -Cycloalkenyl, gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl, Halogen, Nitro, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy carbonyl oder Acylamino substituiertes Phenyl, einen 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der

5 Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, oder einen Benzotriazolrest,  $C_6$ - $C_7$ -Cycloalkanimino, Phthalimido, Succinimido, für die Reste



$-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_2(\text{OH})$ , für ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali-, Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substituiertes Ammonium oder für den Rest



20 wobei  $\text{R}^8$  und  $\text{R}^9$  unabhängig voneinander  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkoxyalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl, Phenyl, Furyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel  $-(\text{CH}_2)_m-$  mit  $m = 4$  bis 7 Kettengliedern bedeuten und  $\text{R}^9$  zusätzlich Wasserstoff bedeutet,  
 25  $\text{R}^6$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl oder  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl und  
 $\text{R}^7$  für Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl stehen oder wobei  
 $\text{R}^6$  und  $\text{R}^7$  eine Methylenkette mit 4 oder 5 Gliedern bilden,  
 $\text{R}^3$  Wasserstoff,  
 gegebenenfalls durch Hydroxy, Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio oder  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino substituiertes  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl

30 oder gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl substituiertes  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl und  
 $\text{R}^4$  Wasserstoff, Hydroxyl,

gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino, Halogen,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl oder Phenyl, das durch Halogen, Cyano, Nitro,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio substituiert sein kann, substituiertes  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,

35 gegebenenfalls durch Halogen oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy substituiertes  $C_3$ - $C_{10}$ -Alkenyl oder  $C_3$ - $C_{10}$ -Alkinyl, gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylthio, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl,

40  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino, einen gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl oder Halogen substituierten 3- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und gegebenenfalls durch Methyl substituierter Stickstoff,

45 oder gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkanoyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkanoyl substituiertes Phenyl bedeuten

oder  
 $\text{R}^3$  und  $\text{R}^4$  gemeinsam einen Rest der Struktur  $-(\text{CH}_2)_n-\text{Y}_p-(\text{CH}_2)_q-$ , wobei  $n$  und  $q$  1, 2 oder 3,  $p$  0 oder 1 und  $\text{Y}$  Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten, oder den Rest der Formel

50  $-(\text{CH}_2)_3-\text{CO}-$  bilden sowie deren umweltverträglichen Salze.

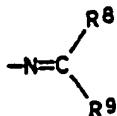
6. Herbizides Mittel, enthaltend inerte Zusatzstoffe und ein Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamid der Formel Ia.

7. Herbizides Mittel gemäß Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, daß es als Wirkstoff ein Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamid der Formel Ia enthält, in der  $\text{R}^3$  Wasserstoff bedeutet.

55 8. Herbizides Mittel gemäß Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, daß es als Wirkstoff ein Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamid der Formel Ia enthält, in der

$\text{R}^1$  Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl.

5  $R^2 = COYR^5$ , wobei Y für Sauerstoff oder Schwefel und  $R^5$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio oder Halogen substituiertes Phenyl oder den Rest



15 stehen,  
 $R^3$  Wasserstoff und  
 $R^4$   $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl bedeuten.  
9. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses, dadurch gekennzeichnet, daß man die unerwünschten Pflanzen und/oder die von unerwünschten Pflanzenwuchs freizuhaltende Fläche mit einer herbizid wirksamen Menge eines Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamids der Formel Ia behandelt.

20 Patentansprüche für folgenden Vertragsstaat: ES

25 1. Verfahren zur Herstellung von Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamiden der Formel I

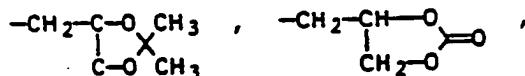


in der

30  $X$  Sauerstoff oder Schwefel,  
 $R^1$  Wasserstoff,  
gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_3$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_3$ -Halogenalkoxy, Halogen, Cyano oder Phenyl, das durch Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio, Cyano oder Nitro substituiert sein kann, substituiertes  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  
35 gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder Halogen substituiertes  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl, gegebenenfalls durch 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, der durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, Carboxyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl substituiert sein kann,  
40 oder gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylthio, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl,  
45  $R^2$  Formyl, 4,5-Dihydro-oxazol-2-yl oder einen Rest der Formel  $COYR^5$  oder  $CONR^6R^7$ , wobei  
Y für Sauerstoff oder Schwefel,  
 $R^5$  für Wasserstoff,  
50  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl, das durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy, Halogen, Cyano, Hydroxy, Trimethylsilyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylsulfonyl, Carboxyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxykarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylaminocarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkoxyphosphonyl, Alkaniminoxy, Benzyloxy, gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_3$ -Alkoxy oder Halogen substituiertes Benzoyl oder gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes Phenyl, durch Thienyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Phthalimido oder Pyridyl substituiert sein kann,  
55 gegebenenfalls durch Phenyl, das durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl, Halogen, Nitro oder Cyano substituiert sein kann, substituiertes  $C_3$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkenyl, gegebenenfalls durch Hydroxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy substituiertes  $C_3$ - $C_8$ -Alkinyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_5$ - $C_6$ -Cycloalkenyl, gegebenenfalls durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl, Halogen, Nitro, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxykarbonyl oder Acylamino substituiertes Phenyl,

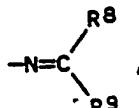
einen 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, oder einen Benzotriazolrest  
 C<sub>6</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkanimino, Phthalimido, Succinimido, für die Reste

5



10 -CH<sub>2</sub>-CH(OH)-CH<sub>2</sub>(OH) , für ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali-, Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substituiertes Ammonium oder für den Rest

15



wobei R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> unabhängig voneinander C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Phenyl, Furyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- mit m = 4 bis 7 Kettengliedern bedeuten und R<sup>9</sup> 20 zusätzlich Wasserstoff bedeutet,

R<sup>6</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl und  
 R<sup>7</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl stehen oder wobei  
 R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> eine Methylenkette mit 4 oder 5 Gliedern bilden,  
 R<sup>3</sup> Wasserstoff,  
 25 gegebenenfalls durch Hydroxy, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylamino substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl  
 oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl und  
 R<sup>4</sup> Wasserstoff, Hydroxyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,  
 30 gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylamino, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl oder Phenyl, das durch Halogen, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio substituiert sein kann, substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl,  
 gegebenenfalls durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Alkinyl,  
 35 gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro oder Cyano substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylamino,  
 einen gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl oder Halogen substituierten 3- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder 40 gegebenenfalls durch Methyl substituierter Stickstoff, Naphthyl,  
 oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkanoyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkanoyl substituiertes Phenyl bedeuten  
 oder  
 45 R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> gemeinsam einen Rest der Struktur -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Y<sub>p</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten, oder den Rest der Formel -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CO- bilden,  
 mit der Maßgabe, daß X Schwefel ist, wenn R<sup>1</sup> CH<sub>3</sub>, R<sup>2</sup> COOH oder COOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub> und R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> Wasserstoff  
 50 bedeuten, und daß X Sauerstoff ist, wenn R<sup>1</sup> Wasserstoff, R<sup>2</sup> COOH oder CONH<sub>2</sub> und R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> Wasserstoff bedeuten, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Isoxazol(Isothioazol)-5-carbonsäurehalogenid der Formel VI

55

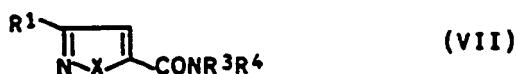


mit einem Amin der Formel V

$\text{HNR}^3\text{R}^4$  (V)

zu einem Isoxazol(Isothiazol)amid der Formel VII

5



10 umsetzt und dieses Amid mit Alkyllithium und Kohlendioxid zu der entsprechenden Isoxazol(Isothiazol)-4-carbonsäure der Formel Ic

15



20

umsetzt und diese Säure durch Veresterung mit einem Alkohol der Formel IX

$\text{HY-R}^5$  (IX)

in Gegenwart eines wasserentziehenden Mittels in ein Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamid der Formel I überführt.

2. Herbizides Mittel, enthaltend inerte Zusatzstoffe und 0,1 bis 95 Gew.% eines Isoxazol(Isothiazol)-5-carbonsäureamids der Formel I

25



30

in der die Substituenten  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ ,  $\text{R}^3$ ,  $\text{R}^4$  und  $\text{X}$  die gleichen Bedeutungen haben wie in Formel I gemäß Anspruch 1, mit der Maßgabe, daß  $\text{X}$  Sauerstoff oder Schwefel bedeutet, wenn  $\text{R}^1$  Wasserstoff oder  $\text{CH}_3$ ,  $\text{R}^2$   $\text{COOH}$ ,  $\text{COOC}_2\text{H}_5$  oder  $\text{CONH}_2$  und  $\text{R}^3$  und  $\text{R}^4$  Wasserstoff bedeuten.

35

40

45

50

55